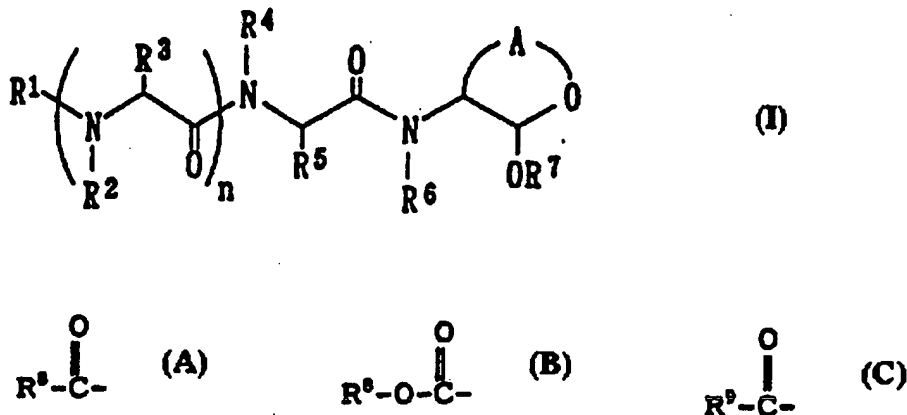




(51) 国際特許分類6 C07D 305/08, 307/22, 309/14, C07H 5/06, 15/18, A61K 31/335, 31/34, 31/35, 31/70		A1	(11) 国際公開番号 WO96/25408
			(43) 国際公開日 1996年8月22日(22.08.96)
(21) 国際出願番号 (22) 国際出願日	PCT/JP96/00286 1996年2月9日(09.02.96)	丹羽卓朗(NIWA, Takuro)[JP/JP] 吉井成彦(YOSHII, Narihiko)[JP/JP] 田畑礼子(TABATA, Reiko)[JP/JP] 斎藤健一(SAITO, Ken-Ichi)[JP/JP] 有友啓一(ARITOMO, Keiichi)[JP/JP] 〒227 神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番地 三菱化学株式会社 横浜総合研究所内 Kanagawa, (JP) 神 敏朗(SAKAKI, Toshiro)[JP/JP] 〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 三菱化学株式会社 医薬カンパニー内 Tokyo, (JP)	
(30) 優先権データ		(74) 代理人 弁理士 長谷川暁司(HASEGAWA, Koji) 〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 三菱化学株式会社内 Tokyo, (JP)	
特願平7/25398	1995年2月14日(14.02.95) JP	(81) 指定国 CA, CN, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
特願平7/25402	1995年2月14日(14.02.95) JP	添付公開書類 国際調査報告書	
特願平7/234236	1995年9月12日(12.09.95) JP		
特願平7/272432	1995年10月20日(20.10.95) JP		
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 三菱化学株式会社 (MITSUBISHI CHEMICAL CORPORATION)[JP/JP] 〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 Tokyo, (JP)			
(72) 発明者：および (75) 発明者／出願人 (米国についてのみ) 安藤亮一(ANDO, Ryoichi)[JP/JP] 増田裕和(MASUDA, Hirokazu)[JP/JP] 稲越直人(INAKOSHI, Naoto)[JP/JP] 直原哲夫(JIKIHARA, Tetsuo)[JP/JP] 藤村義幸(FUJIMURA, Yoshiyuki)[JP/JP]			

(54) Title: OXYGEN-CONTAINING HETEROCYCLIC DERIVATIVES

(54) 発明の名称 含酸素複素環誘導体

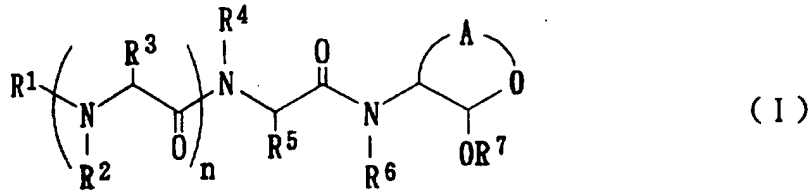


(57) Abstract

An oxygen-containing heterocyclic derivative represented by general formula (I), a salt thereof, a solvate thereof or a hydrate thereof: wherein R¹ represents hydrogen, A, B, etc., (wherein R⁸ represents C₁₋₂₀ alkyl, aryl, etc.); R², R⁴ and R⁶ represent each hydrogen, C₁₋₅ alkyl, etc.; R³ and R⁵ represent each hydrogen, C₁₋₂₀ alkyl, etc.; R⁷ represents hydrogen, C, etc. (wherein R⁹ represents C₁₋₁₀ alkyl); A represents C₁₋₃ alkylene; and n is 0 or 1. The derivative, which has a potent inhibitory effect on a cysteine protease and is excellent in oral absorbability, tissue transmigration properties and cell membrane-permeability, is useful as a remedy for apoplexy, Alzheimer's diseases, etc.

(57) 要約

下記一般式 (I) で表される含酸素複素環誘導体、その塩、その溶媒和物またはその水和物。



R¹ : 水素原子、R² - C(=O)-、R³ - O - C(=O)-等

(R² : C₁ ~ C₂₀のアルキル基、アリアル基等)

R⁴、R⁵、R⁶ : 水素原子、C₁ ~ C₅のアルキル基等

R⁷、R⁸ : 水素原子、C₁ ~ C₂₀のアルキル基等

R⁹ : 水素原子、R¹⁰ - C(=O)-等

(R¹⁰ : C₁ ~ C₁₀のアルキル基)

A : C₁ ~ C₃のアルキレン基

n : 0 または 1

本発明の含酸素複素環誘導体はシステインプロテアーゼに対して強い阻害作用を示し、また経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にもすぐれており、脳卒中、アルツハイマー病等の治療薬として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を特定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LC	セントルシア	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	PR	プエルトリコ
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
AZ	アゼルバイジャン	FI	フィンランド	LS	レソト	SD	スーダン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FR	フランス	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	GB	イギリス	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SI	スロベニア
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MA	モロッコ	SK	スロバキア
BG	ブルガリア	GR	ギリシャ	MD	モルドバ共和国	SN	セネガル
BJ	ベナン	HU	ハンガリー	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BR	ブラジル	IE	アイルランド	MK	マケドニア共和国	TD	チャド
BY	ベラルーシ	IL	イスラエル	ML	マリ	TG	トーゴ
CA	カナダ	IT	イタリア	MN	モンゴル	TJ	タジキスタン
CC	中東ケニア	JP	日本	MR	モーリタニア	TM	トルクメニスタン
CG	コンゴ	KE	ケニア	MW	マラウイ	TT	トリニダード・トバゴ
CH	スイス	KG	キルギスタン	MX	メキシコ	UA	ウクライナ
CI	コートジボワール	KR	朝鮮民主主義人民共和国	NE	ニジェール	UG	ウガンダ
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NL	オランダ	US	米国
CU	キューバ	KZ	カザフスタン	NO	ノルウェー	UZ	ウズベキスタン
CZ	チェコ共和国			NZ	ニュージーランド	VN	ベトナム

明 細 書

含酸素複素環誘導体

5 技術分野

この発明は新規な含酸素複素環誘導体に関する。

背景技術

10 パパイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン、
インターロイキン1 β 変換酵素等のシステインプロテアーゼの生体内での
働きが解明されるに従い、その異常亢進が種々の疾病の原因であることが
判明してきており、またシステインプロテアーゼ阻害剤がそれらの疾患の
動物モデルで有効であったという報告が増えつつある。

15 筋ジストロフィー、筋萎縮症などの筋疾患で見られる骨格筋崩壊におい
て、カルパインやカテプシンBなどのシステインプロテアーゼは、筋繊維
蛋白質の分解を通じてZ線の消失などの初期過程に関与していると考えら
れている（代謝、25巻、臨時増刊号「代謝病ハイライト」、183ペー
ジ、1988年）。また、システインプロテアーゼ阻害剤であるE-64
-dは、筋ジストロフィー症ハムスターにおいて延命効果があったと報告
20 されている（Journal of Pharmacobio Dynamics, 10巻、678ページ、1987年）。したがって、システ
インプロテアーゼ阻害剤は筋ジストロフィー、筋萎縮症等の治療薬になると
考えられる。

25 心筋梗塞や脳卒中等の虚血性疾患において、虚血後の細胞障害の主な原
因は、キサンチン酸化酵素が産生する活性酵素である。虚血の過程で上昇
したCa²⁺濃度によって活性化されたカルパインがキサンチン酸化酵素の

前駆体であるキサンチン脱水素酵素を限定分解して酸化酵素に変換しているという説がある (New England Journal of Medicine, 312巻、159ページ、1985年)。また、カルパインの活性化が心筋細胞死や脳神経細胞死の直接的な原因にもなりうると考えられている (最新医学、43巻、783ページ、1988年)。カルパインの阻害剤であるNCO-700が心筋梗塞の動物モデルで効果があることが報告されており (Arzneimittel Forschung/Drug Research, 36巻、190ページ、671ページ、1986年)、またE-64-cは脳虚血後の微小管結合蛋白の分解を抑制している (Brain Research, 526巻、177ページ、1990年)。したがって、カルパインの阻害剤は心筋梗塞や脳卒中などの虚血性疾患の治療薬になると考えられる。

アルツハイマー病患者の脳に特有に見られる老人斑にはアミロイドという蛋白が沈着しているが、このアミロイドはアミロイド蛋白前駆体 (APP) の分解により生成することが知られている。APPの正常代謝ではアミロイドは生成しないが、異常亢進したプロテアーゼによる異常代謝によりアミロイドが生成し、これが老人斑になると考えられている (Scientific American, 1991年11月号、40ページ)。したがって、プロテアーゼの阻害剤は、アルツハイマー病の治療薬になると期待されている。

うさぎの頭部外傷モデルにおいて、カルパインが活性化されていることが報告されており (Neurochemical Research, 16巻、483ページ、1991年)、またラットの頭部外傷モデルにおいて、カルパイン阻害剤であるロイペプチンを投与することにより、軸索の保護作用が観察されている (Journal of Neurosurgery, 65巻、92ページ、1986年)。したがって、カルパインの

阻害剤は頭部外傷において意識障害改善や運動障害改善等の効果があると考えられる。

神経細胞の樹状突起に存在するミエリン結合蛋白がカルパインにより分解されるという報告がある (Journal of Neurochemistry, 47巻、1007ページ、1986年)。したがって、カルパインの阻害剤が神経細胞の脱髄によって起こるといわれる疾患、例えば多発性硬化症や末梢神経のニューロパシーに対して効果があると考えられる。

白内障のうちの多くのものは、水晶体中の水溶性蛋白であるクリスタリンがプロテアーゼの働きにより加水分解されるために水晶体の白濁が生じると言われている。実験モデルでの白内障およびヒトのある種の白内障では、水晶体内のカルシウム濃度が上昇しており (Investigative Ophthalmology & Visual Science, 28巻、1702ページ、1987年、Experimental Eye Research, 34巻、413ページ、1982年)、また水晶体中に含まれるプロテアーゼのうち最も多いのはカルパインであることから (Lens and Eye Toxicity Research, 6巻、725ページ、1989年)、カルパインの異常亢進が白内障の原因の一つであると考えられている。カルパインの阻害剤であるE-64が白内障の実験モデルで効果があったという報告 (Investigative Ophthalmology & Visual Science, 32巻、533ページ、1991年) もあることから、カルパインの阻害剤は白内障の治療薬になると考えられる。

炎症とのかかわりあいが深い好中球は、走行化因子やホルボールエステルによる刺激に対して脱顆粒やスーパーオキシドの産生で応答することが知られており、これはプロテインキナーゼC (PKC) によって媒介され

ていると考えられている。カルパインはこのPKCを活性化する働きをしており、脱顆粒には促進的に、スーパーオキシド産生には抑制的に作用しているという報告がある (Journal of Biological Chemistry, 263巻、1915ページ、1988年)。また、
5 ラットのマクロファージにおけるカテプシンBの濃度が、白血球や好中球の場合よりも30~40倍高く、しかも炎症マクロファージの酵素濃度の方が普通のマクロファージより6倍高いと報告されている (Journal of Biochemistry, 98巻、87ページ、1985年)。さらに最近、プレインターロイキン1 β をインターロイキン1 β に変換する酵素 (インターロイキン1 β 変換酵素) がシステインプロテアーゼであることが判明し (Nature, 356巻、768ページ、1992年)、
10 炎症の発現にシステインプロテアーゼの活性化が重要な働きをしていることが明らかになった。これらのことから、システインプロテアーゼの阻害剤は、抗炎症剤として用いることができると考えられる。

15 I型アレルギー反応は、生体が抗原に感作されることにより産生した免疫グロブリンE (IgE) を介して進行する。システインプロテアーゼ阻害剤であるエスタチンAはIgEの産生を特異的に抑制し、IgGの産生には影響を与えないと報告されている (The Journal of Antibiotics, 42巻、1362ページ、1989年)。したがって、システインプロテアーゼ阻害剤は、抗アレルギー剤として用いる
20 ことができると考えられる。

肝細胞が壊死する場合には、細胞膜の障害によりCa²⁺の透過性が増して細胞内のCa²⁺濃度が高まってカルパインが活性化されるために、その基質である骨格蛋白等の分解が起きて細胞死にいたると考えられている。
25 したがって、カルパインの阻害剤は劇症肝炎の治療薬として用いることができる。

カテプシンB、カテプシンL等のカテプシン類は、破骨細胞内での骨コラーゲンの分解に関与している。副甲状腺ホルモンを投与して骨破壊を亢進させたラットに、カテプシン類の阻害剤であるE-64、あるいはエステチンAを投与すると、血中カルシウム濃度およびヒドロキシプロリン濃度
5 度が低下することが報告されている (Biochemical and Biophysical Research Communication, 125巻、441ページ、1984年、特開平2-218610号公報)。したがって、カテプシン類の阻害剤は骨粗鬆症や高カルシウム血症の治療薬になると考えられる。

10 カルパインの基質として、エストロゲン受容体やアンドロゲン受容体等の性ホルモン受容体がある。カルパインはこれらの受容体を活性化させることが知られており、カルパインの異常亢進は性ホルモン受容体の異常活性化によると考えられる疾患、例えば乳癌、前立腺癌、前立腺肥大等をひきおこすと言われている。したがって、カルパインの阻害剤は上記の疾患
15 の治療薬になると考えられる。

細胞の癌化に伴い、表皮増殖因子 (EGF) 受容体が活性化されると言われており、カルパインはEGF受容体を基質としてこれを活性化することが知られている。また、成人T細胞性ヒト白血病ウィルス (ATLV/HTLV-1) に感染した細胞において、カルパインが活性化されていたとの報告がある (生化学、57巻、1202ページ、1985年)。一方、
20 カテプシンBが癌の転移の重要な段階であるコラーゲン分解を促進したり、あるいは直接コラーゲンを分解することや、新生物細胞の原形質膜と関係が深いことなどから、癌の転移のプロセスに大きく関与していると言われている。(Tumor Progression and Markers, 47ページ、1982年、Journal of Biological
25 al Chemistry, 256巻、8536ページ、1984年)。

これらのことから、システインプロテアーゼの阻害剤は、癌の増殖抑制、
転移予防に効果があると考えられる。

血小板が活性化されると凝集を起こし、血栓の原因となる。カルパイン
の阻害剤であるE-64-dが、トロンビンで惹起される血小板凝集を抑
5 制したとの報告がある(Thrombosis Research, 57
巻、847ページ、1990年)。したがって、カルパインの阻害剤は血
小板凝集抑制剤として用いることができる。

以上述べてきたように、システインプロテアーゼの異常亢進は種々の疾
患の原因となり、またいくつかのシステインプロテアーゼ阻害剤は動物モ
10 デルなどで有効だと報告されている。

しかしながら既知の阻害剤は、E-64 (Agricultural
and Biological Chemistry, 42巻、529ペ
ージ、1978年)、E-64-d (Journal of Bioch
emistry, 93巻、1305ページ、1983年)、NCO-70
15 0 (特開昭58-126879号公報)、エスタチンA、B (The J
ournal of Antibiotics, 42巻、1362ページ、
1989年)等のエポキシコハク酸誘導体あるいはペプチドのクロロメチ
ルケトン (Journal of Biochemistry, 99巻、
173ページ、1986年)やアシルオキシメチルケトン (Bioche
20 mistry, 30巻、4678ページ、1991年)に代表されるペプ
チドの α -置換ケトンなど、不可逆阻害剤がほとんどである。一般に不可
逆阻害剤は標的酵素以外の生体構成成分と非特異的に反応しやすいために
毒性が強いと言われており、臨床で用いられた化合物は少ない。また、可
逆阻害剤としてはロイペプチン (The Journal of Ant
25 ibiotics, 22巻、283ページ、1969年)、カルペプチン
(Journal of Enzyme Inhibition, 3巻、

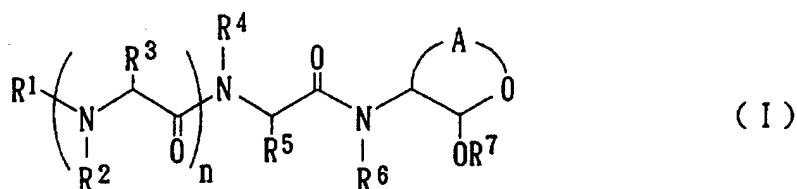
195ページ、1990年)等のペプチジルアルデヒドが知られているが、化学的な安定性、生体内での安定性、細胞膜の透過性などに問題があると言われている。

5 発明の開示

そこで本発明者らは、経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性などに優れたシステインプロテアーゼの阻害剤について研究を進めた結果、本発明を完成するに至った。

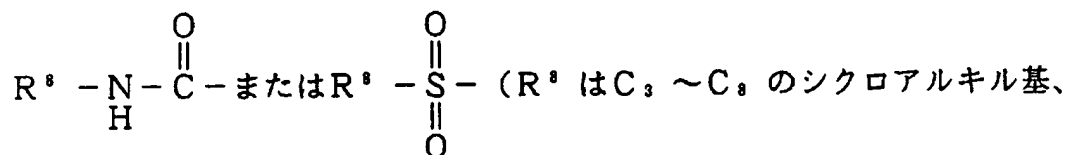
すなわち、本発明の要旨は下記一般式 (I)

10



15

(上記一般式 (I) 中、 R^1 は水素原子、 $\text{R}^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ 、 $\text{R}^8 - \text{O} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ 、



20

$\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ のシクロアルキルオキシ基、フルオレニル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールチオ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_{20}$ のアルキル基； $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ のシクロアルキル基；置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基

25

- で置換されていてもよいC₂～C₅のアルケニル基；または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、R²、R⁴およびR⁶はそれぞれ独立して水素原子、C₁～C₅のアルキル基またはC₂～C₅のアルカノイル基を表し、R³およびR⁵はそれぞれ独立して水素原子；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基、水酸基、C₁～C₅のアルコキシ基、C₁～C₅のアルキルチオ基およびC₇～C₁₂のアラルキルオキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₂₀のアルキル基；または置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基を表し、R⁷は水素原子、C₁～C₅のアルキル基または $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R⁸はC₁～C₁₀のアルキル基または置換基を有していてもよいC₆～C₁₂のアリール基を表す)を表し、AはC₁～C₃のアルキル基を有していてもよいC₁～C₃のアルキレン基を表し、nは0または1を表す)で表される含酸素複素環誘導体、薬学的に許容されるその塩、またはその溶媒もしくは水和物に存する。

以下、本発明について詳細に説明する。

- 上記一般式(I)において、R⁸で定義されるC₁～C₂₀のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基、トリデシル基、テトラデシル基、ペンタデシル基、オクタデシル基等が挙げられ、かかるアルキル基は、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基等のC₃～C₈のシクロアルキル基；シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシ

ルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シクロオクチルオキシ基等のC₃～C₈のシクロアルキルオキシ基；フルオレニル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基等のC₁～C₅のアルコキシ基；フェニル基、ナフチル基、アントリル基等のC₆～C₁₄のアリール基；フェノキシ基、ナフトキシ基等のC₆～C₁₄のアリールオキシ基；フェニルチオ基、ナフチルチオ基等のC₆～C₁₄のアリールチオ基；フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基等のC₆～C₁₄のアリールスルホニル基；およびフラン環、ジヒドロフラン環、テトラヒドロフラン環、ピラン環、ジヒドロピラン環、テトラヒドロピラン環、ベンゾフラン環、イソベンゾフラン環、クロメン環、クロマン環、イソクロマン環、チオフェン環、ベンゾチオフェン環、ピロール環、ピロリン環、ピロリジン環、イミダゾール環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ピラゾール環、ピラゾリン環、ピラゾリジン環、トリアゾール環、テトラゾール環、ピリジン環、ピリジンオキシド環、ピペリジン環、ピラジン環、ピペラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、インドリジン環、インドール環、インドリン環、イソインドール環、イソインドリン環、インダゾール環、ベンゾイミダゾール環、プリン環、キノリジン環、キノリン環、フタラジン環、ナフチリジン環、キノキサリン環、キナゾリン環、シンノリン環、プテリジン環、オキサゾール環、オキサゾリジン環、イソキサゾール環、イソキサゾリジン環、チアゾール環、チアジリジン環、イソチアゾール環、イソチアゾリジン環、ジオキサン環、ジチアン環、モルホリン環、チオモルホリン環等の酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれるヘテロ原子を1～4個有し、環を構成する総原子数が5～10の複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。R⁸で定義されるC₃～C₈のシクロアルキル基およびC₆～C₁₄のアリール基としては、

上記のC₁ ~ C₂₀のアルキル基の置換基として挙げたのと同様の基が挙げられる。C₂ ~ C₅のアルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、1-ペンテニル基等が挙げられ、かかるプロペニル基は上記のC₁ ~ C₂₀のアルキル基の置換基として挙げたのと同様のC₆ ~ C₁₄のアリール基で置換されていてもよい。複素環残基としては、C₁ ~ C₂₀のアルキル基の置換基として挙げたのと同様の基が挙げられる。

R²、R⁴およびR⁶で定義されるC₁ ~ C₅のアルキル基としては、それぞれ独立してメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基等が挙げられ、C₂ ~ C₅のアルカノイル基としては、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、バレリル基等が挙げられる。

R³およびR⁵で定義されるC₁ ~ C₂₀のアルキル基としては、それぞれ独立してR⁶で定義したのと同様の基が挙げられ、かかるアルキル基は、R⁶で定義したのと同様のC₆ ~ C₁₄のアリール基；水酸基；R⁶で定義したのと同様のC₁ ~ C₅のアルコキシ基；メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基等のC₁ ~ C₅のアルキルチオ基；およびベンジルオキシ基、フェニルメトキシ基、ナフチルメトキシ基等のC₇ ~ C₁₂のアラルキルオキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。C₆ ~ C₁₄のアリール基としては、上記で定義したのと同様の基が挙げられる。

R⁷で定義されるC₁ ~ C₅のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基が挙げられる。

R⁹ で定義されるC₁ ~ C₁₀のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、
5 オクチル基、ノニル基、デシル基等が挙げられ、C₆ ~ C₁₂のアリール基としては、フェニル基、ナフチル基等が挙げられる。

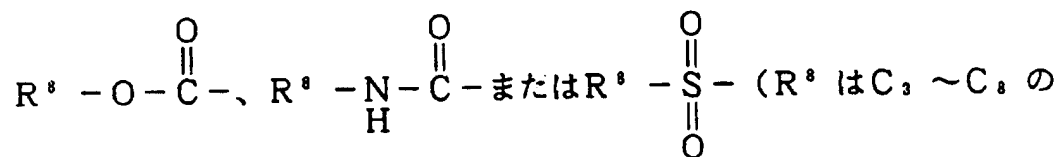
Aで定義されるC₁ ~ C₃のアルキレン基としては、メチレン基、エチレン基、プロピレン基が挙げられ、かかるアルキレン基は、メチル基、エチル基、プロピル基等のC₁ ~ C₃のアルキル基を1 ~ 2個有していても
10 よい。

さらに上記の定義中、各置換基の端部に位置するアリール基および複素環残基は、さらにフッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基等のC₁ ~ C₅のアルキル基；
15 トリフルオロメチル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基等のC₁ ~ C₅のアルコキシ基；メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、プロピレンジオキシ基等のC₁ ~ C₅のアルキレンジオキシ基；水酸基；ニトロ基；アセトキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、バレリルオキシ基等のC₂ ~ C₅のアルキルカルボニルオキシ基；カルボキシ基；メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等のC₂ ~ C₅のアルコキシカルボニル基；オキシ基；アセチル基、プロピオニル基、ブチリ
20

25

- ル基、バレリル基等のC₂～C₆のアルキルカルボニル基；アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、イソペンチルアミノ基等のC₁～C₅のモノアルキル
- 5 アミノ基；ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基等のC₂～C₁₀のジア
- ルキルアミノ基；アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、イソプロピ
- オニルアミノ基、ブチリルアミノ基、バレリルアミノ基等のC₂～C₆の
- 10 アルキルカルボニルアミノ基；カルバモイル基；メチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、プロピルカルバモイル基、ブチルカルバモイル基、tert-ブチルカルバモイル基、ペンチルカルバモイル基等のC₂～C₆のアルキルカルバモイル基およびフェニル基、ナフチル基等のC₆～C₁₂のアリール基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。

- 15 本願発明のうち、好ましい化合物としてはR¹が水素原子、R²- $\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-$ 、



- シクロアルキル基、フルオレニル基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄の
- 20 アリール基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールオキシ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールチオ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₂₀のアルキル基；C₃～C₈のシクロアルキル基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基で置換されていてもよいC₂～C₅のアルケニル基；
- 25

または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4
 および R^6 がそれぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基または
 $C_2 \sim C_6$ のアルカノイル基を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して
 水素原子；または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基およ
 5 び $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有
 していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が水素原子、 $C_1 \sim$
 C_5 のアルキル基または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基また
 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表し、 A
 10 が $C_1 \sim C_3$ のアルキル基を有していてもよい $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基
 を表し、 n が0または1を表す化合物が挙げられる。これらの化合物のう
 ち、 R^2 、 R^4 および R^6 がそれぞれ独立して水素原子または $C_1 \sim C_5$
 のアルキル基を表す化合物がより好ましく、 n が0を表す化合物がさらに
 好ましい。特に好ましい化合物としては、

15 $(1) R_1$ が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$
 のアリール基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、
 置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基および置換基を有
 していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールスルホニル基からなる群より選ばれ
 20 る1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基；置換基を
 有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい C_6
 $\sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_2 \sim C_5$ のアルケニル基；
 または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4
 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim$
 25 C_{20} のアルキル基を表し、 R^7 が水素原子または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^9 は C_1

~C₁₀のアルキル基を表す)を表し、AがC₁~C₃のアルキレン基を表し、nが0を表す化合物、

(2) R₁がR⁸-O-C(=O)- (R⁸はC₃~C₈のシクロアルキル基、
 5 フルオレニル基、置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂₀のアルキル基; C₃~C₈のシクロアルキル基; または置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基を表す)を表し、R²、R⁴およびR⁶が水素原子を表し、R³およびR⁵
 10 がそれぞれ独立して水素原子; または置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基およびC₁~C₅のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂₀のアルキル基を表し、R⁷が

水素原子またはR⁹-C(=O)- (R⁹はC₁~C₁₀のアルキル基を表す)を表し、AがC₁~C₃のアルキレン基を表し、nが0を表す化合物、
 15

(3) R₁がR⁸-N(H)-C(=O)- (R⁸は置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基を表す)を表し、R²、R⁴およびR⁶が水素原子を表し、R³およびR⁵がそれぞれ独立してC₁~C₂₀のアルキル基を表し、
 20

R⁷が水素原子またはR⁹-C(=O)- (R⁹はC₁~C₁₀のアルキル基または置換基を有していてもよいC₆~C₁₂のアリール基を表す)を表し、AがC₁~C₃のアルキレン基を表し、nが0を表す化合物、および

(4) R₁がR⁸-S(=O)₂- (R⁸は置換基を有していてもよいC₆~C₁₄
 25

のアリール基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が水素原子、 $C_1 \sim C_3$ のアル

- 5 キル基または $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^8 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表し、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキル基を有していてもよい $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基を表し、 n が 0 を表す化合物が挙げられる。

- 10 上記(1)の化合物のうち、 R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 が

- 15 それぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す)を表し、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基を表し、 n が 0 を表す化合物がより好ましい。

- 20 上記(2)の化合物のうち、 R_1 が $R^8 - \text{O} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^8 はフルオレニル基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基または $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ の

- 25 アルキル基を表し、 R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す)を表し、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基を表し、 n が 0 を表す化合

物がより好ましい。

上記(3)の化合物のうち、 R^7 が水素原子を表す化合物がより好ましい。

5 上記(4)の化合物のうち、 R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} - \overset{\text{O}}{\parallel}$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す)を表し、 R^7 が $C_1 \sim C_5$ のアルキル基を表す化合物、および R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} - \overset{\text{O}}{\parallel}$ (R^8 は置換基を有して

10 いてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す)を表し、 R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel} \text{C} -$ (R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表す化合物がより好ましい。

15 上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環誘導体は、薬学的に許容される塩を形成することができる。かかる塩の具体例としては、酸性基が存在する場合には、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩、またはアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩を形成することができ、塩基性基が存在する場合には塩酸塩、臭酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩を形成する

20

25 ことができる。また、上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環

上記一般式 (I) で表される本発明の含酸素複素環誘導体の具体的な例としては、 $n = 0$ で R^1 が水素原子の場合は下記表 - 1 に示す化合物が、 $n = 0$ で R^1 が水素原子ではない場合は下記表 - 2 に示す化合物が、 $n = 1$ で R^1 が水素原子の場合は下記表 - 3 に示す化合物が、 $n = 1$ で R^1 が水素原子ではない場合は下記表 - 4 に示す化合物が挙げられる。

表 - 1 (n = 0 の場合)

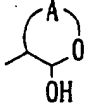
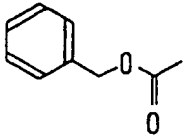
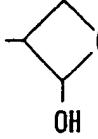
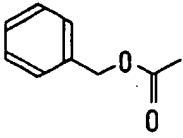
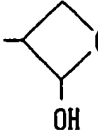
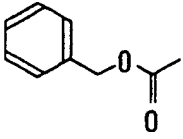
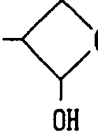
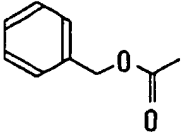
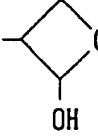
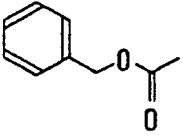
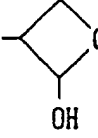
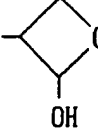
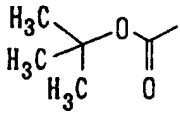
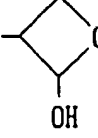
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1		-H	-H	-H	
2		-H	-CH ₃	-H	
3		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
4		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
5		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
6	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
7		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

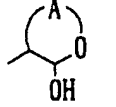
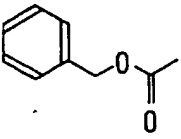
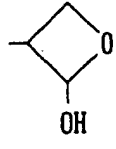
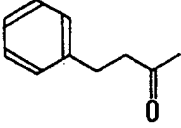
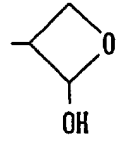
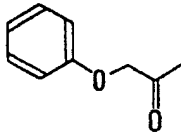
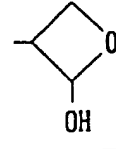
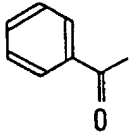
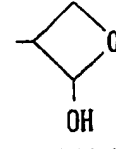
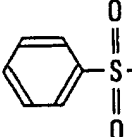
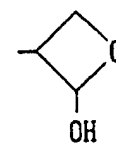
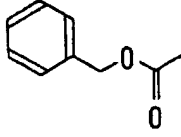

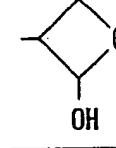
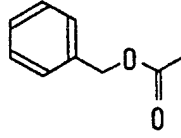
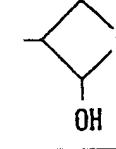
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
8		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
9		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
10		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
11		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
12		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
13		-H	-CH ₂ - 	-H	
14		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	

表 - 1 (つづき)

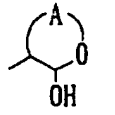
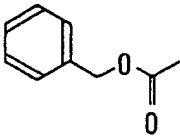
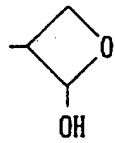
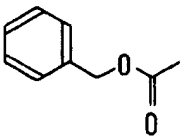

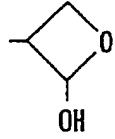
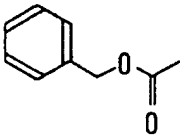
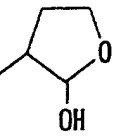
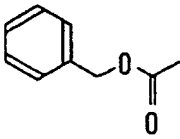
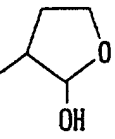
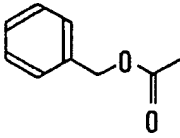
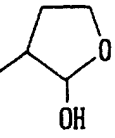
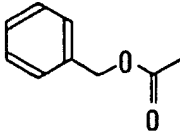
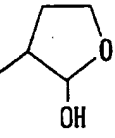
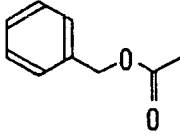
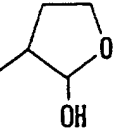
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
15		-H	-CH ₂ OH	-H	
16		-H		-H	
17		-H	-H	-H	
18		-H	-CH ₃	-H	
19		-H	-CH ₂ CH ₃	-H	
20		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
21		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

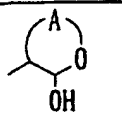
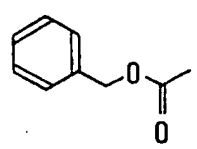
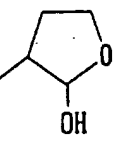
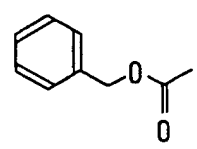
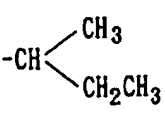
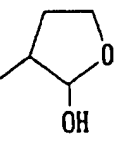
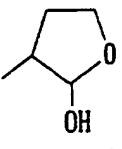
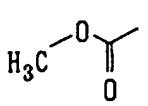
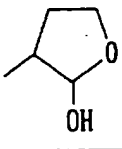
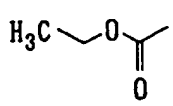
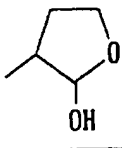
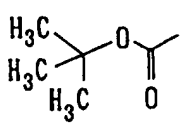
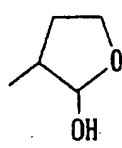
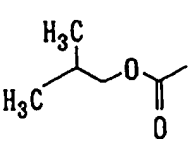
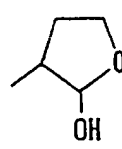
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
22		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
23		-H		-H	
24	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
25		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
26		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
27		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
28		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

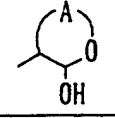
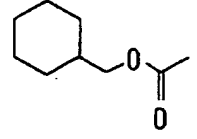
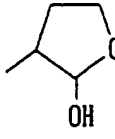
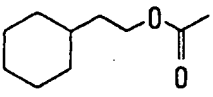
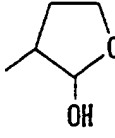
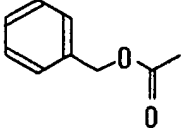
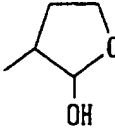
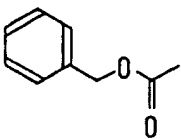
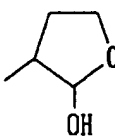
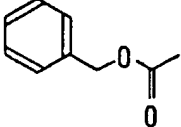
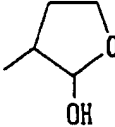
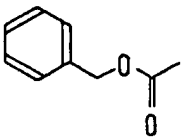
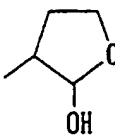
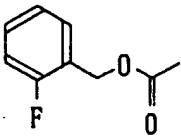
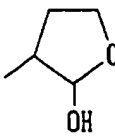
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
29		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
30		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
31		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
32		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
33		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
34		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
35		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

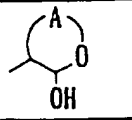
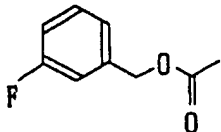
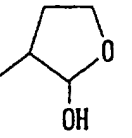
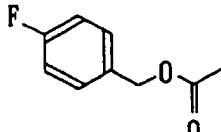
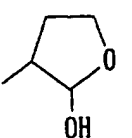
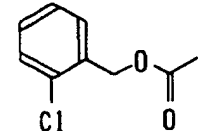
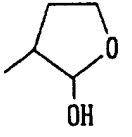
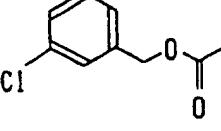
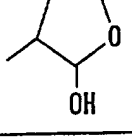
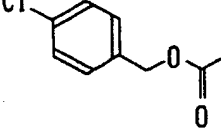
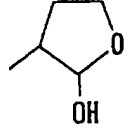
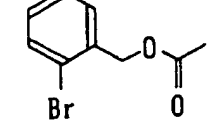
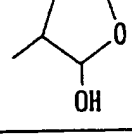
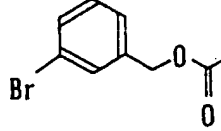
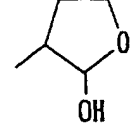
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
36		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
37		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
38		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
39		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
40		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
41		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
42		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

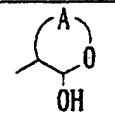
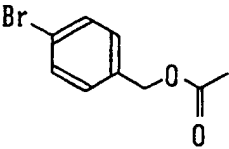
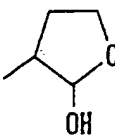
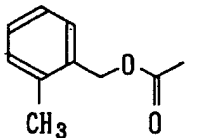
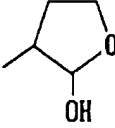
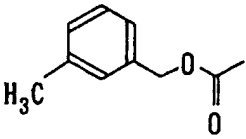
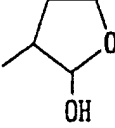
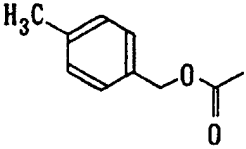
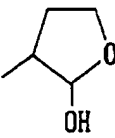
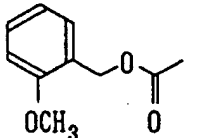
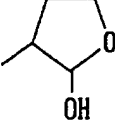
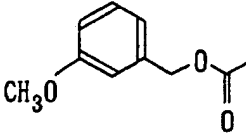
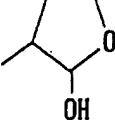
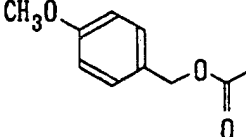
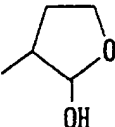
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
43		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
44		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
45		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
46		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
47		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
48		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
49		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

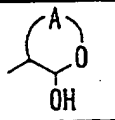
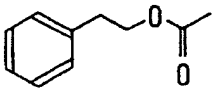
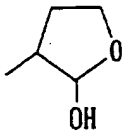
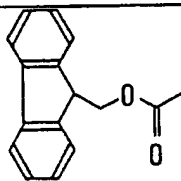
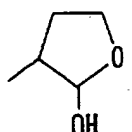
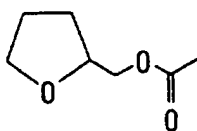
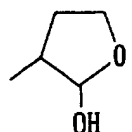
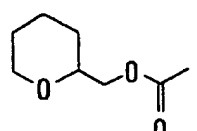
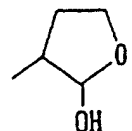
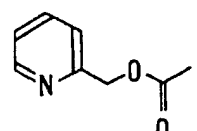
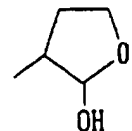
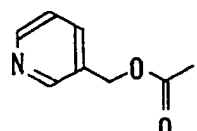
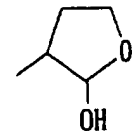
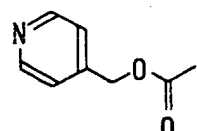
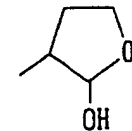
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
50		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
51		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
52		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
53		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
54		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
55		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
56		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

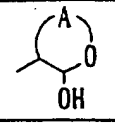
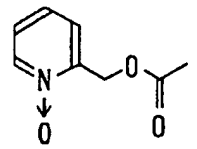
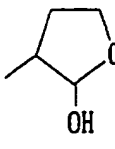
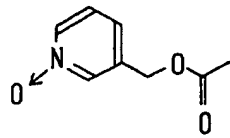
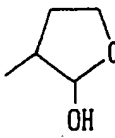
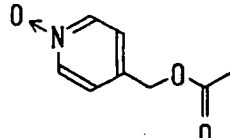
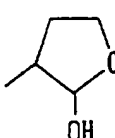
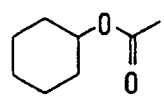
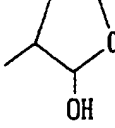
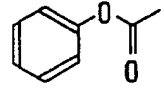
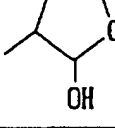
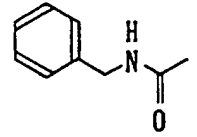
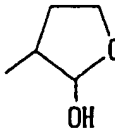
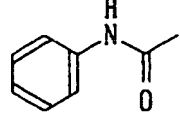
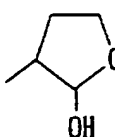
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
57		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
58		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
59		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
60		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
61		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
62		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
63		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

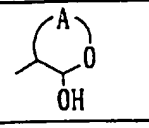
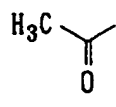
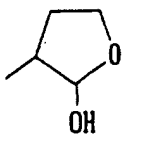
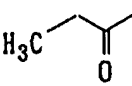
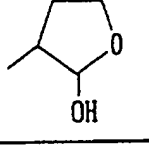
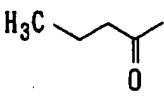
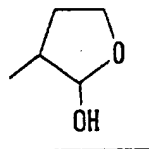
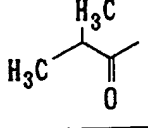
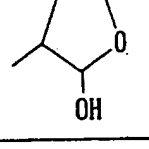
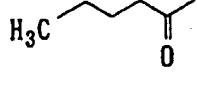
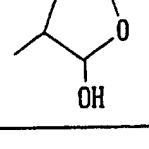
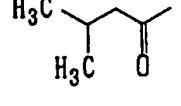
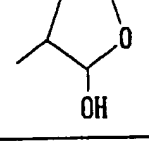
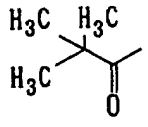
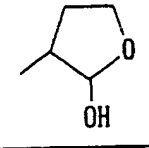
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
64		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
65		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
66		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
67		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
68		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
69		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
70		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

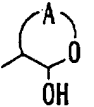
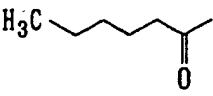
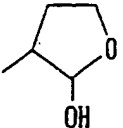
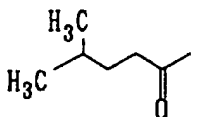
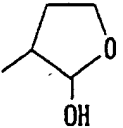
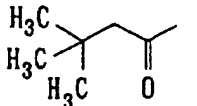
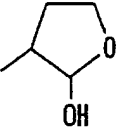
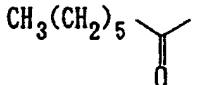
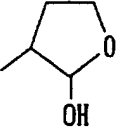
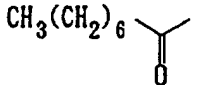
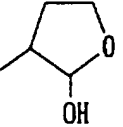
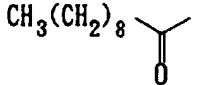
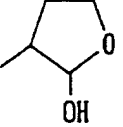
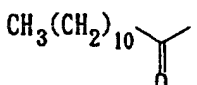
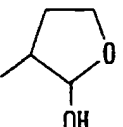
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
71		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
72		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
73		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
74		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
75		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
76		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
77		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

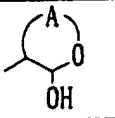
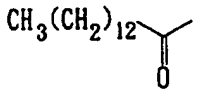
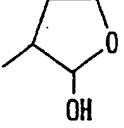
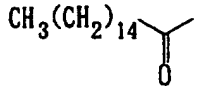
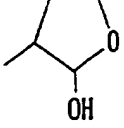
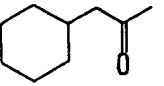
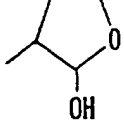
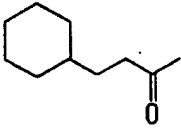
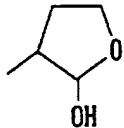
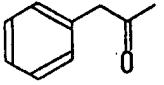
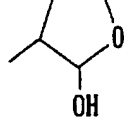
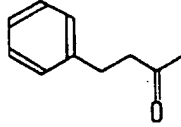
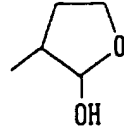
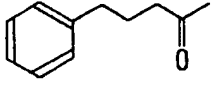
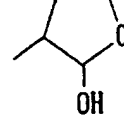
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
78		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
79		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
80		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
81		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
82		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
83		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
84		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

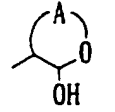
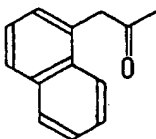
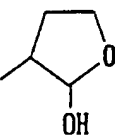
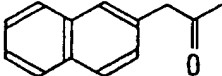
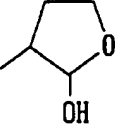
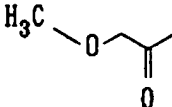
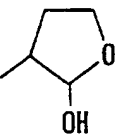
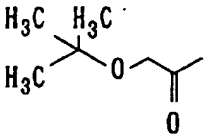
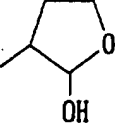
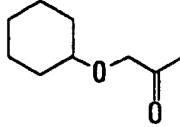
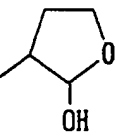
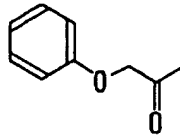
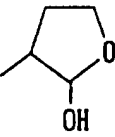
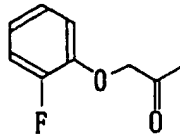
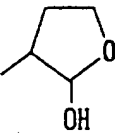
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
85		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
86		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
87		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
88		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
89		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
90		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
91		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

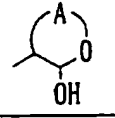
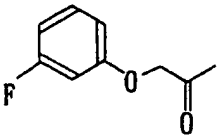
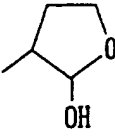
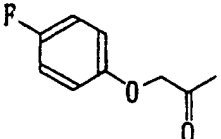
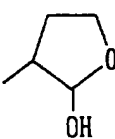
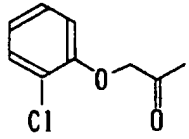
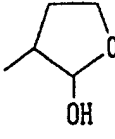
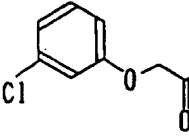
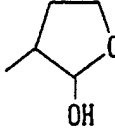
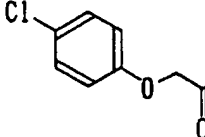
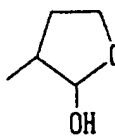
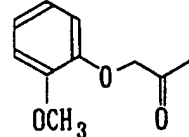
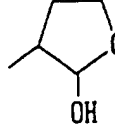
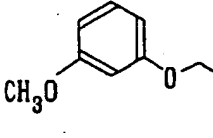
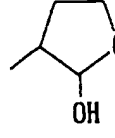
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
92		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
93		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
94		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
95		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
96		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
97		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
98		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

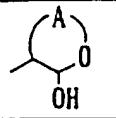
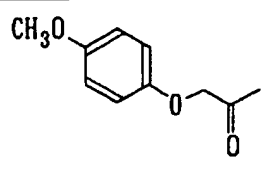
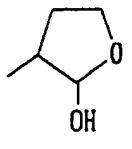
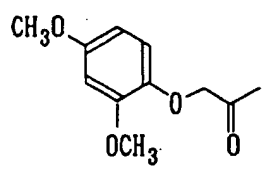
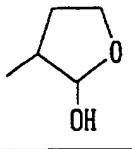
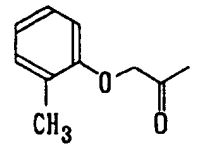
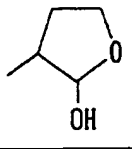
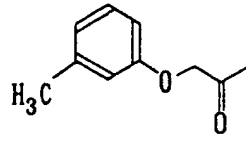
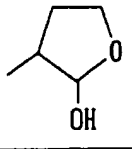
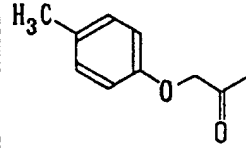
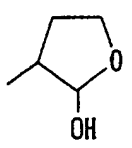
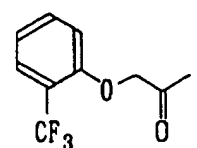
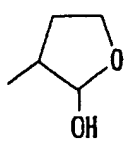
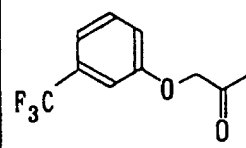
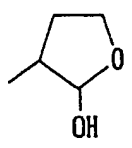
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
99		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
100		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
101		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
102		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
103		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
104		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
105		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

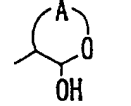
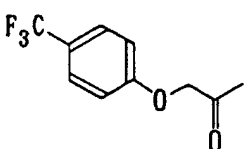
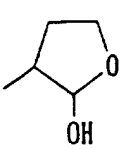
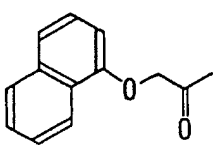
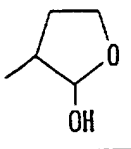
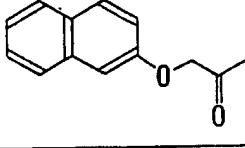
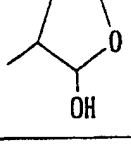
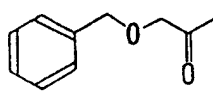
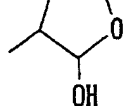
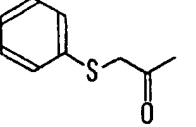
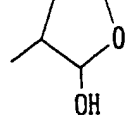
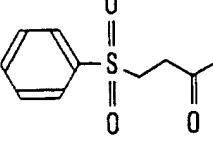
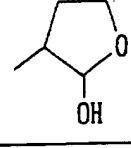
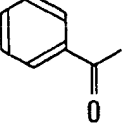
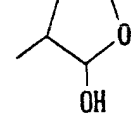
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
106		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
107		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
108		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
109		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
110		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
111		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
112		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

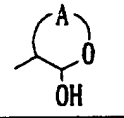
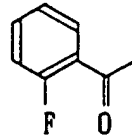
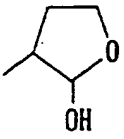
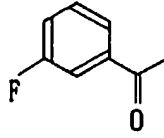
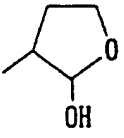
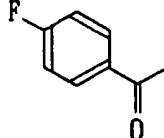
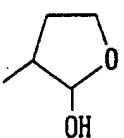
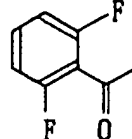
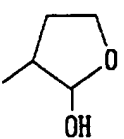
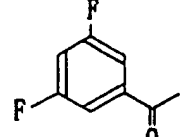
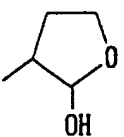
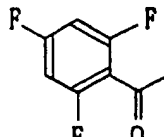
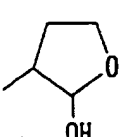
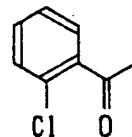
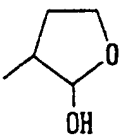
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
113		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
114		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
115		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
116		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
117		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
118		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
119		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

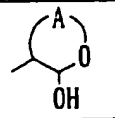
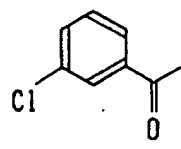
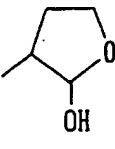
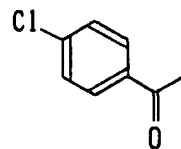
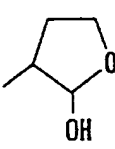
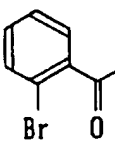
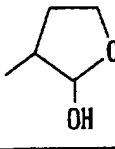
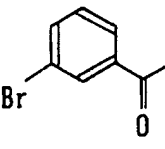
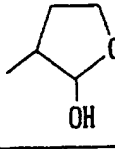
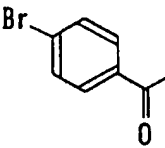
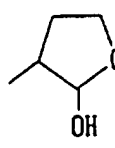
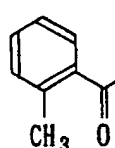
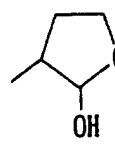
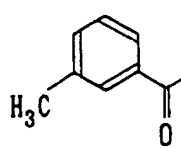
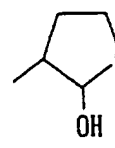
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
120		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
121		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
122		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
123		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
124		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
125		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
126		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

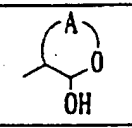
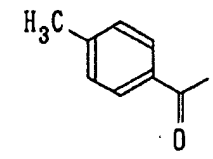
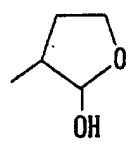
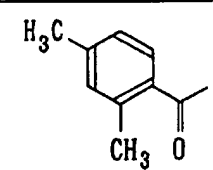
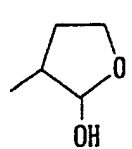
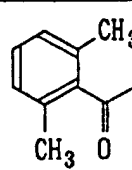
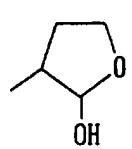
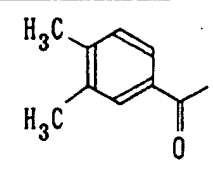
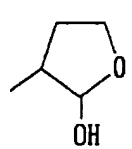
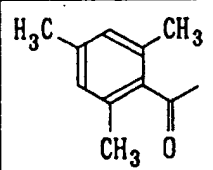
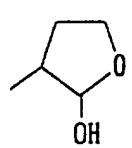
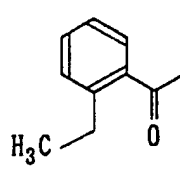
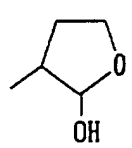
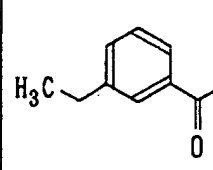
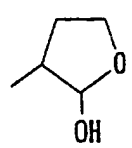
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
127		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
128		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
129		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
130		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
131		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
132		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
133		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

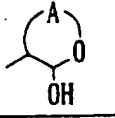
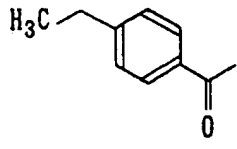
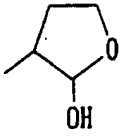
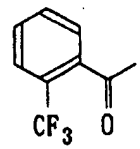
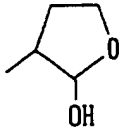
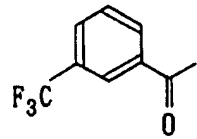
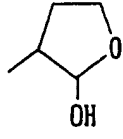
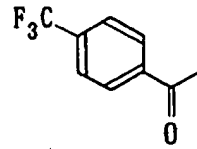
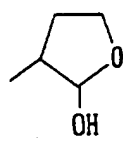
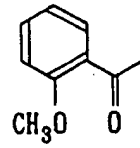
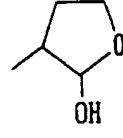
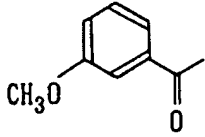
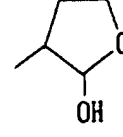
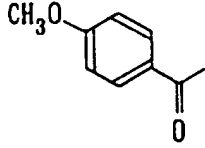
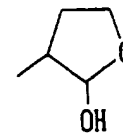
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
134		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
135		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
136		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
137		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
138		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
139		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
140		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

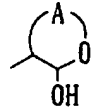
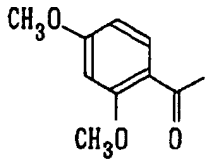
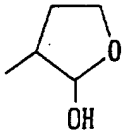
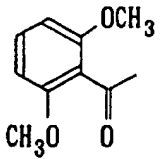
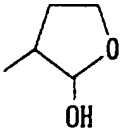
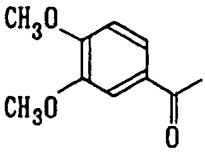
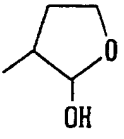
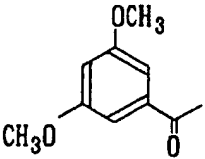
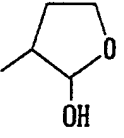
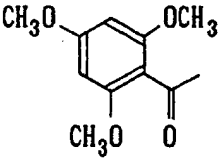
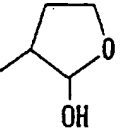
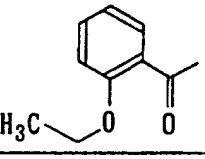
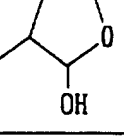
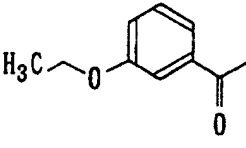
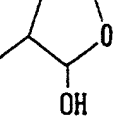
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
141		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
142		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
143		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
144		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
145		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
146		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
147		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

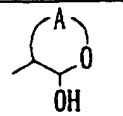
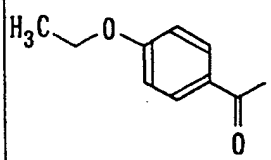
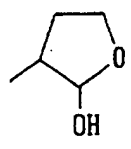
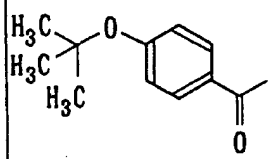
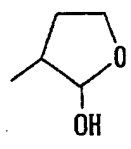
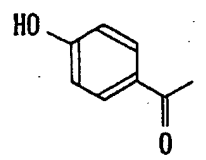
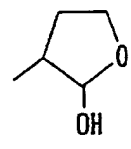
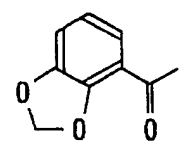
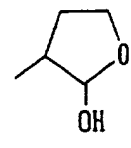
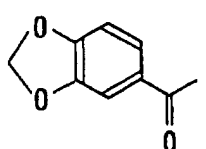
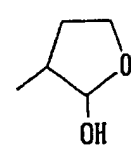
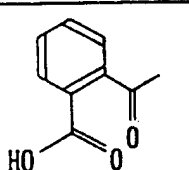
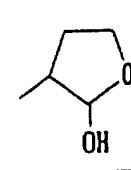
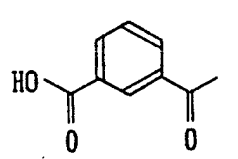
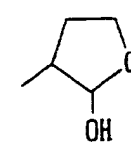
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
148		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
149		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
150		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
151		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
152		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
153		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
154		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

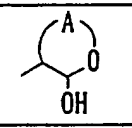
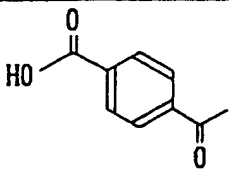
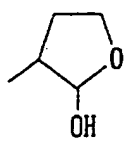
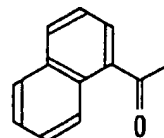
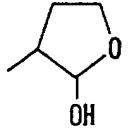
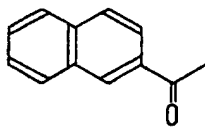
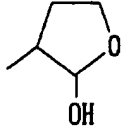
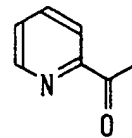
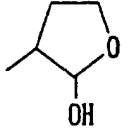
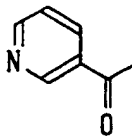
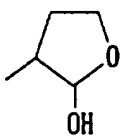
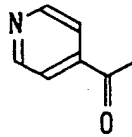
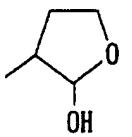
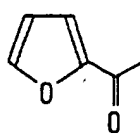
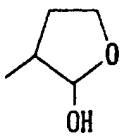
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
155		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
156		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
157		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
158		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
159		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
160		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
161		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

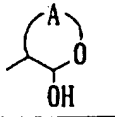
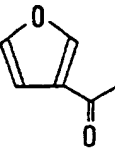
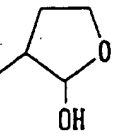
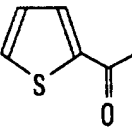
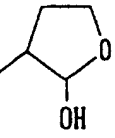
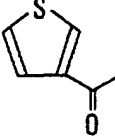
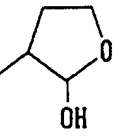
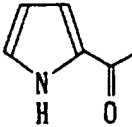
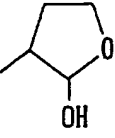
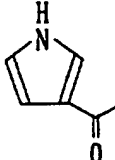
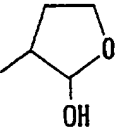
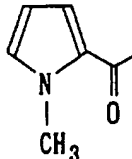
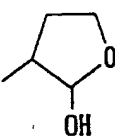
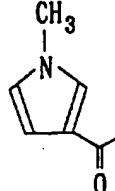
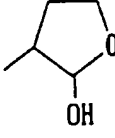
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
162		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
163		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
164		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
165		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
166		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
167		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
168		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

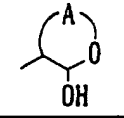
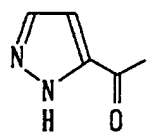
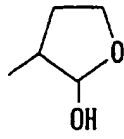
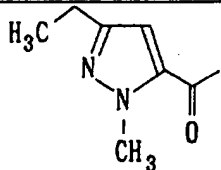
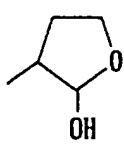
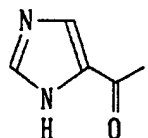
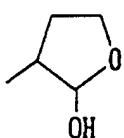
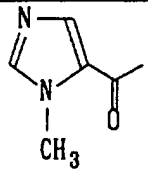
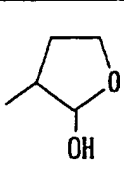
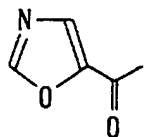
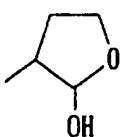
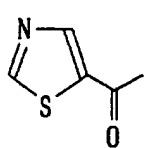
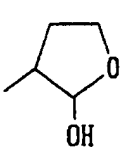
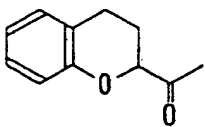
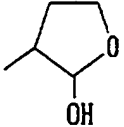
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
169		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
170		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
171		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
172		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
173		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
174		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
175		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

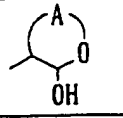
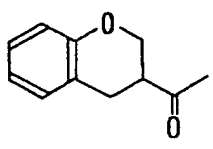
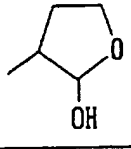
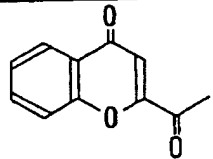
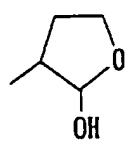
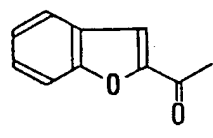
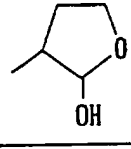
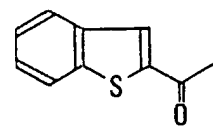
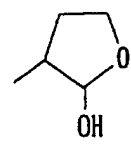
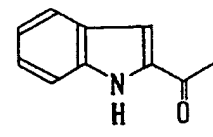
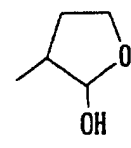
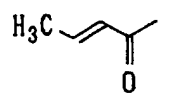
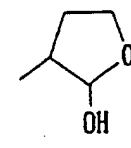
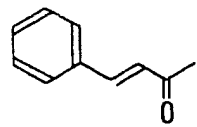
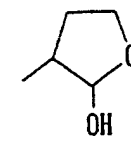
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
176		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
177		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
178		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
179		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
180		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
181		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
182		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

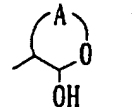
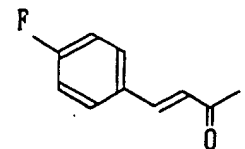
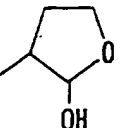
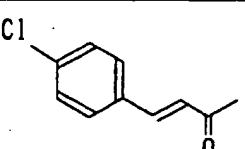
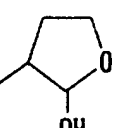
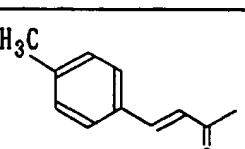
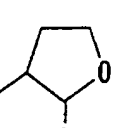
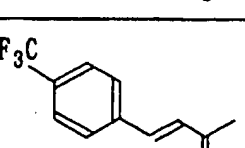
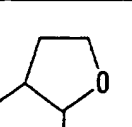
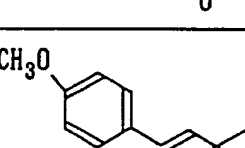
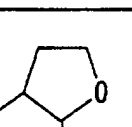
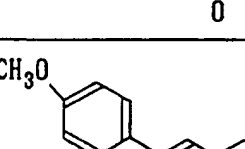
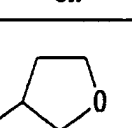
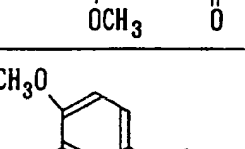
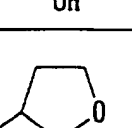
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
183		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
184		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
185		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
186		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
187		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
188		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
189		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

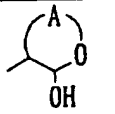
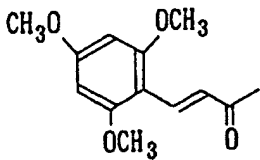
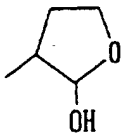
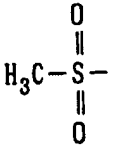
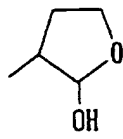
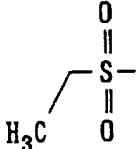
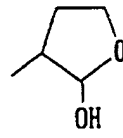
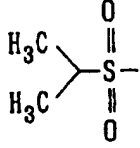
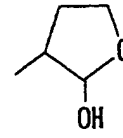
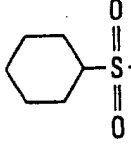
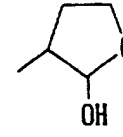
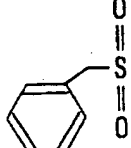
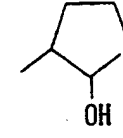
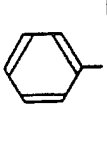
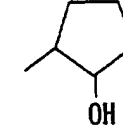
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
190		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
191		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
192		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
193		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
194		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
195		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
196		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

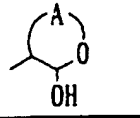
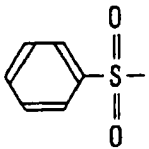
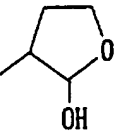
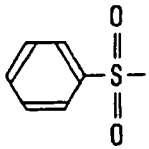
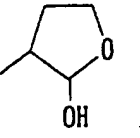
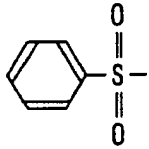
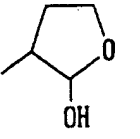
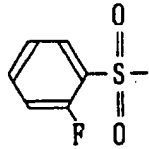
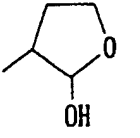
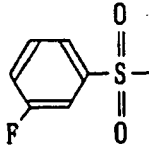
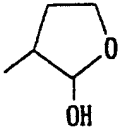
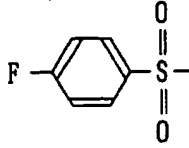
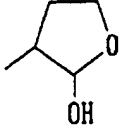
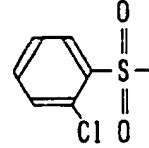
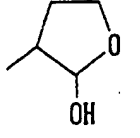
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
197		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
198		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
199		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
200		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
201		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
202		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
203		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

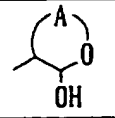
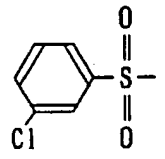
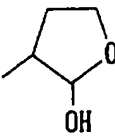
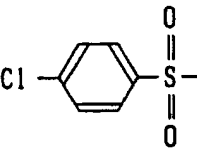
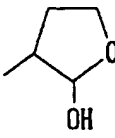
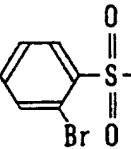
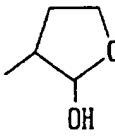
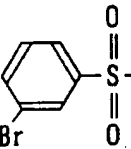
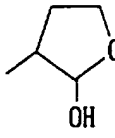
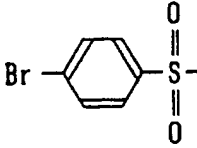
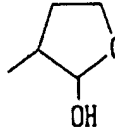
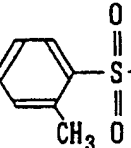
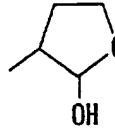
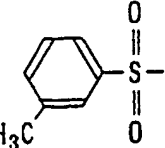
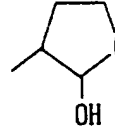
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
204		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
205		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
206		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
207		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
208		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
209		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
210		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

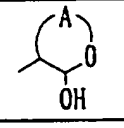
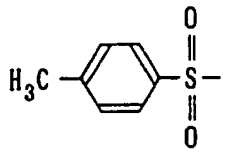
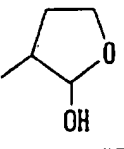
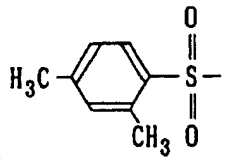
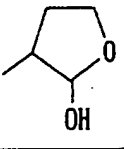
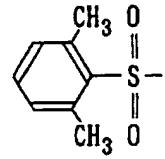
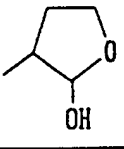
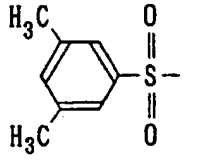
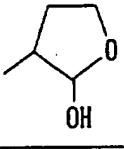
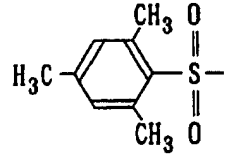
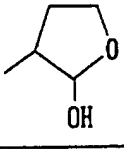
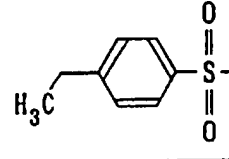
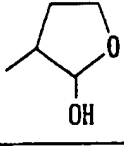
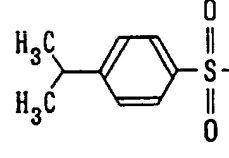
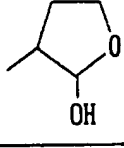
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
211		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
212		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
213		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
214		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
215		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
216		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
217		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

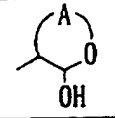
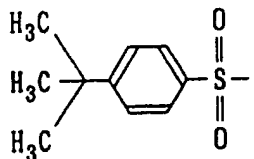
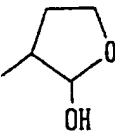
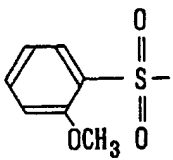
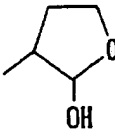
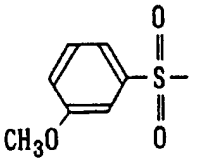
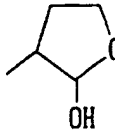
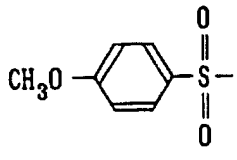
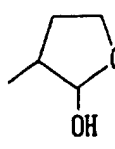
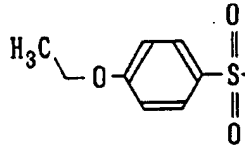
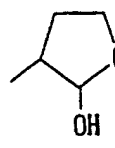
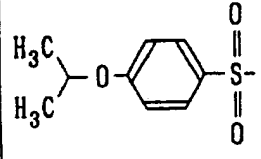
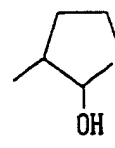
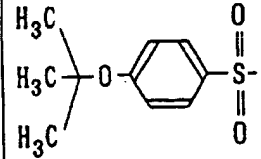
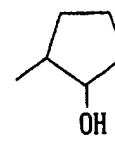
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
218		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
219		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
220		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
221		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
222		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
223		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
224		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

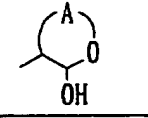
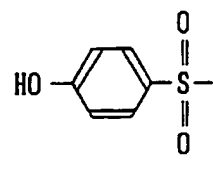
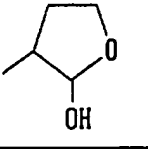
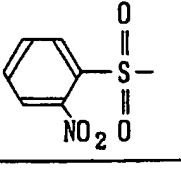
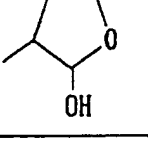
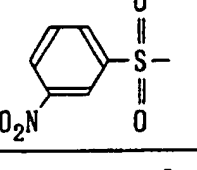
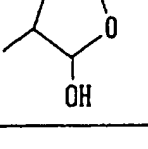
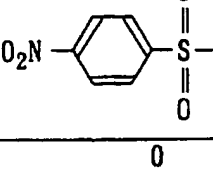
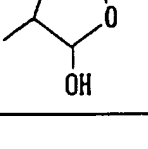
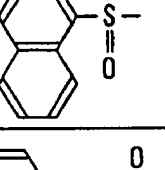
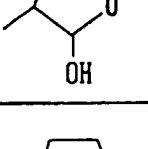
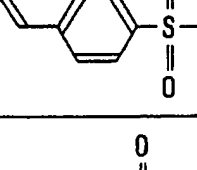
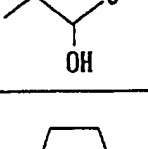
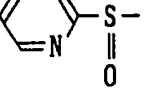
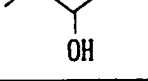
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
225		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
226		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
227		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
228		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
229		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
230		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
231		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

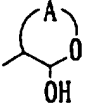
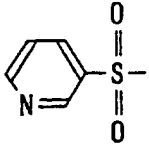
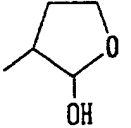
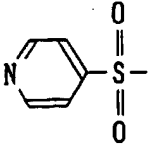
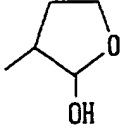
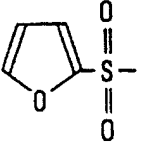
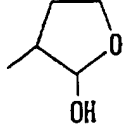
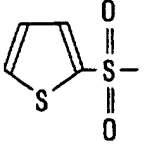
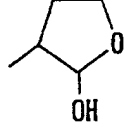
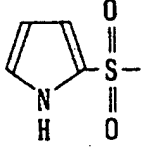
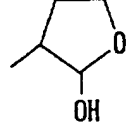
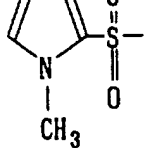
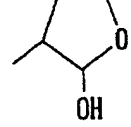
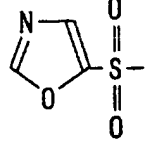
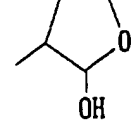
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
232		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
233		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
234		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
235		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
236		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
237		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
238		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

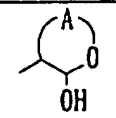
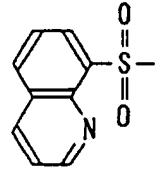
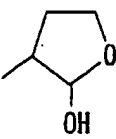
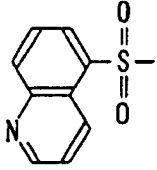
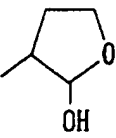

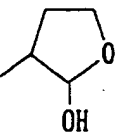
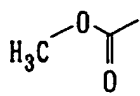

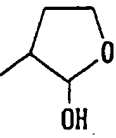
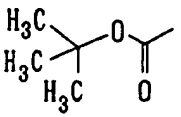

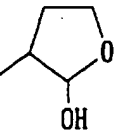
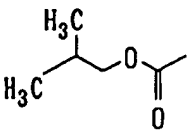

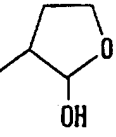
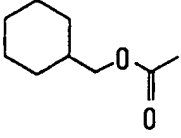

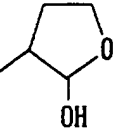
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
239		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
240		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
241	H-	-H	-CH ₂ - 	-H	
242		-H	-CH ₂ - 	-H	
243		-H	-CH ₂ - 	-H	
244		-H	-CH ₂ - 	-H	
245		-H	-CH ₂ - 	-H	

表 - 1 (つづき)

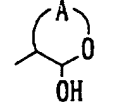
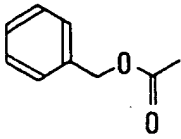
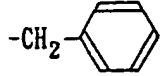
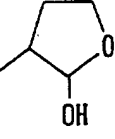
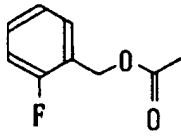
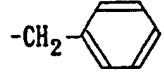
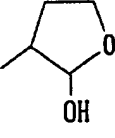
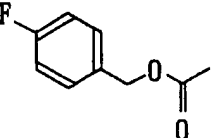
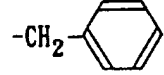
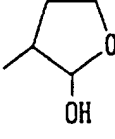
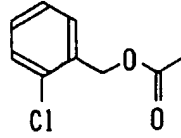
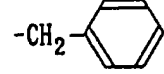
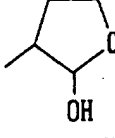
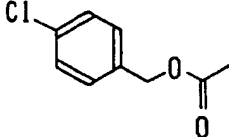
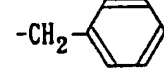
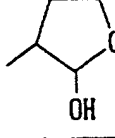
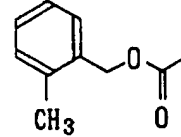
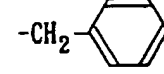
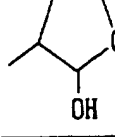
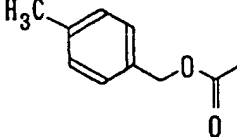
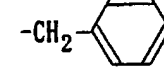
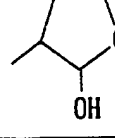
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
246		-H		-H	
247		-H		-H	
248		-H		-H	
249		-H		-H	
250		-H		-H	
251		-H		-H	
252		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

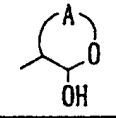
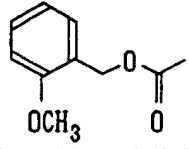
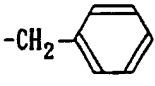
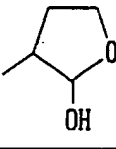
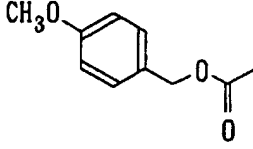
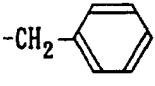
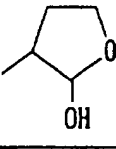
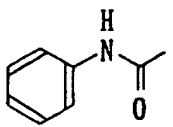
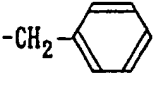
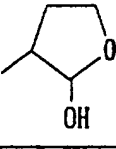
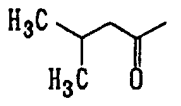
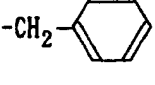
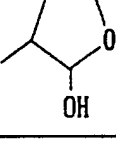
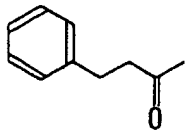
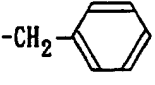
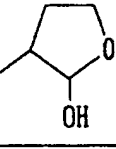
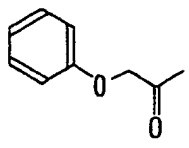
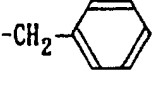
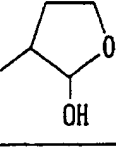
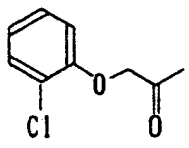
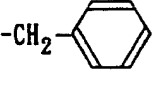
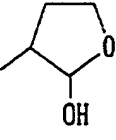
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
253		-H		-H	
254		-H		-H	
255		-H		-H	
256		-H		-H	
257		-H		-H	
258		-H		-H	
259		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

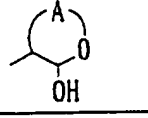
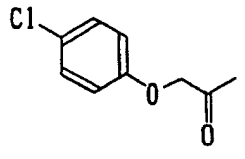
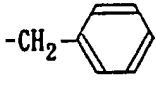
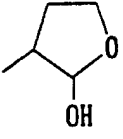
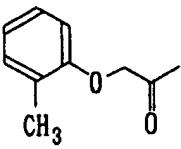
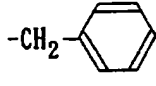
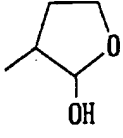
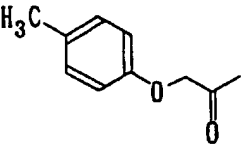
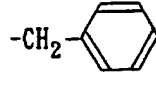
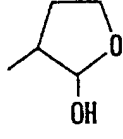
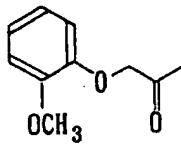
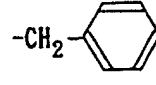
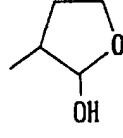
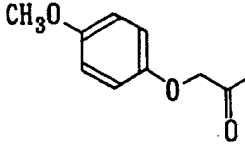
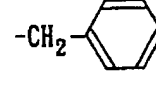
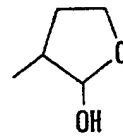
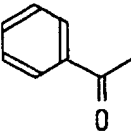
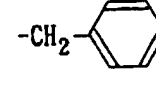
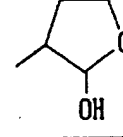
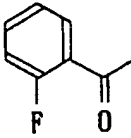
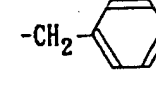
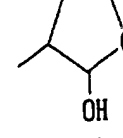
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
260		-H		-H	
261		-H		-H	
262		-H		-H	
263		-H		-H	
264		-H		-H	
265		-H		-H	
266		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

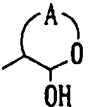
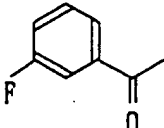
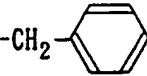
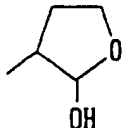
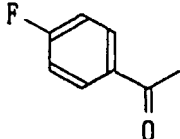
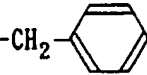
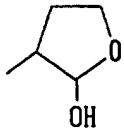
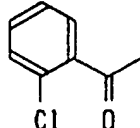
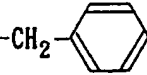
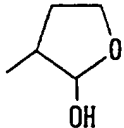
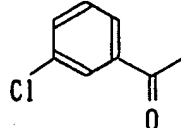
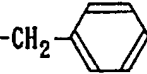
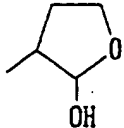
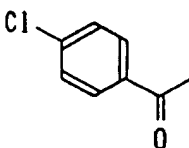
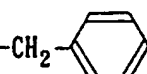
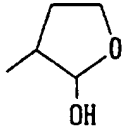
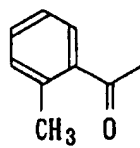
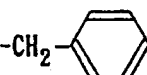
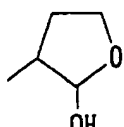
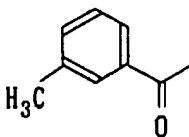
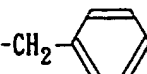
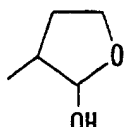
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
267		-H		-H	
268		-H		-H	
269		-H		-H	
270		-H		-H	
271		-H		-H	
272		-H		-H	
273		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

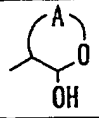
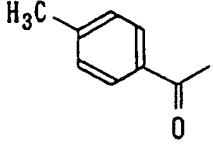
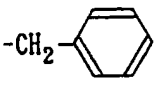
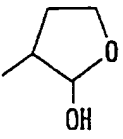
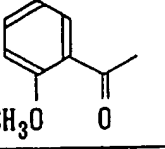
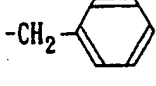
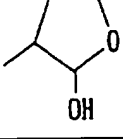
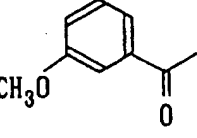
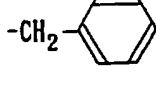
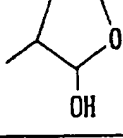
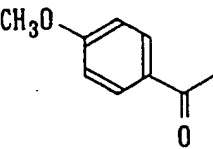
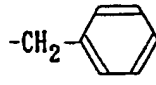
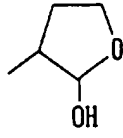
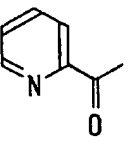
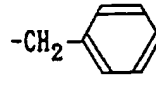
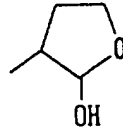
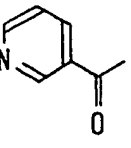
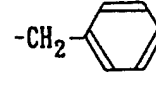
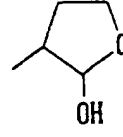
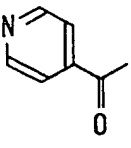
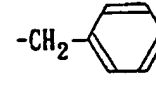
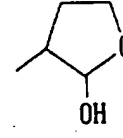
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
274		-H		-H	
275		-H		-H	
276		-H		-H	
277		-H		-H	
278		-H		-H	
279		-H		-H	
280		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

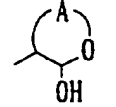
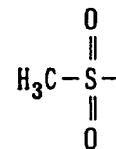
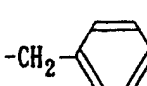
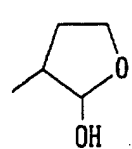
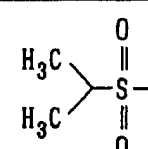
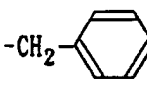
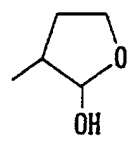
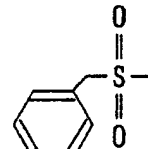
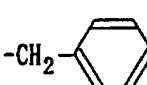
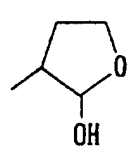
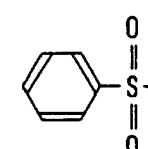
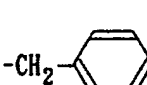
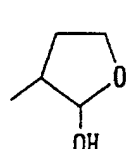
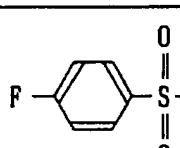
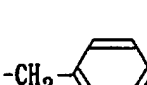
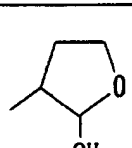
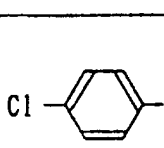
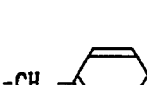
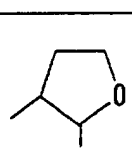
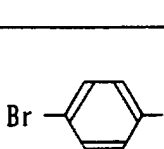
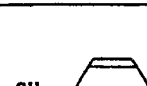
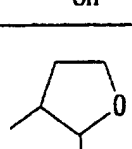
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
281		-H		-H	
282		-H		-H	
283		-H		-H	
284		-H		-H	
285		-H		-H	
286		-H		-H	
287		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

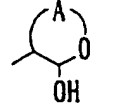
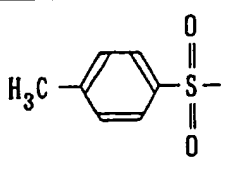
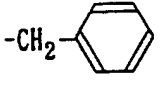
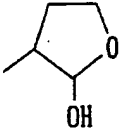
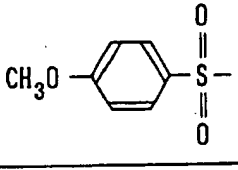
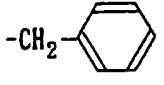
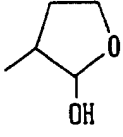
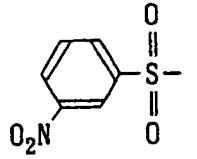
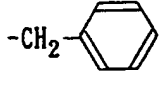
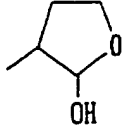
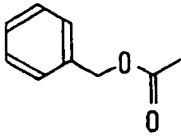
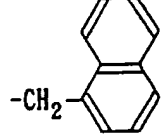
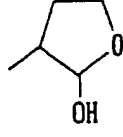
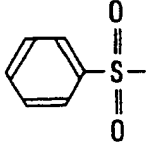
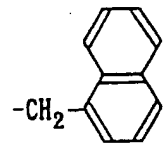
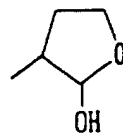
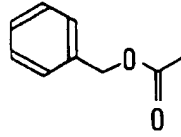
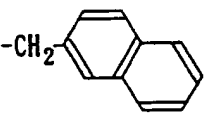
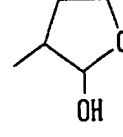
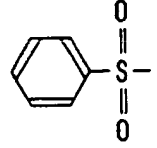
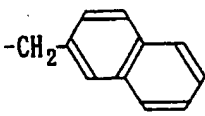
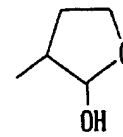
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
288		-H		-H	
289		-H		-H	
290		-H		-H	
291		-H		-H	
292		-H		-H	
293		-H		-H	
294		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

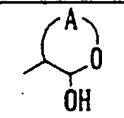
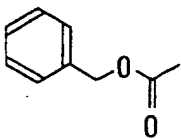
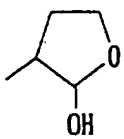
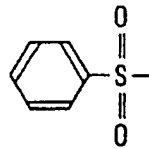
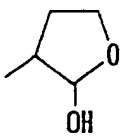
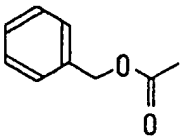
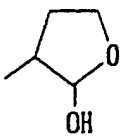
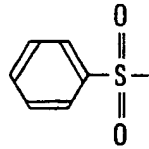
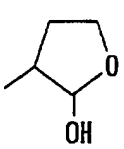
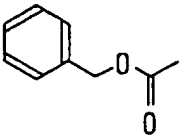

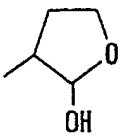
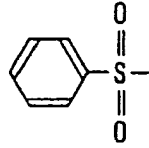

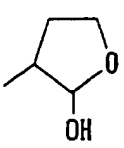
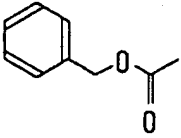
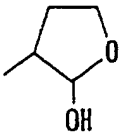
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
295		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
296		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
297		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
298		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
299		-H	-CH ₂ OCH ₂ - 	-H	
300		-H	-CH ₂ OCH ₂ - 	-H	
301		-H	-CH ₂ OH	-H	

表 - 1 (つづき)

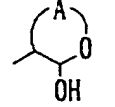
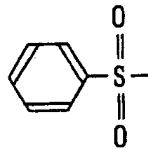
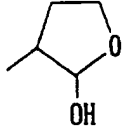
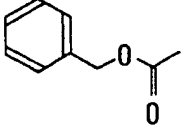
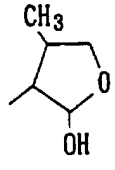
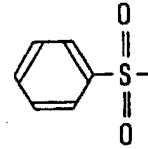
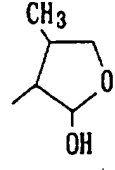
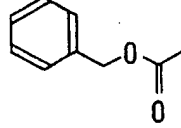
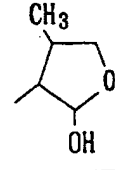
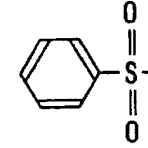
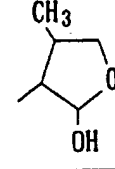
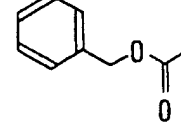
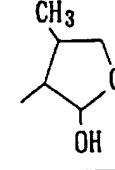
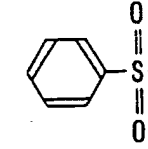
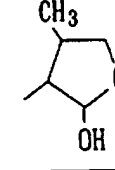
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
302		-H	-CH ₂ OH	-H	
303		-H	-H	-H	
304		-H	-H	-H	
305		-H	-CH ₃	-H	
306		-H	-CH ₃	-H	
307		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
308		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	

表 - 1 (つづき)

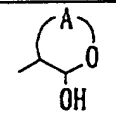
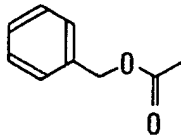
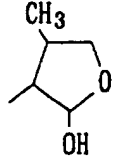
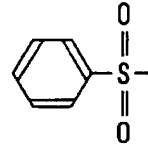
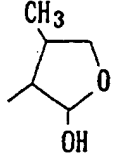
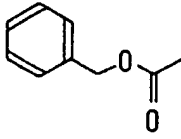
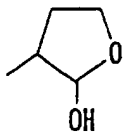
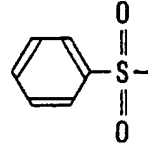
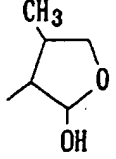
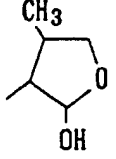
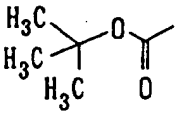
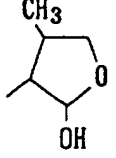
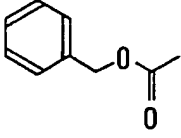
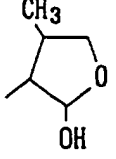
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
309		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
310		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
311		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
312		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
313	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
314		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
315		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

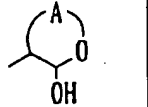
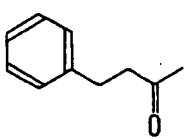
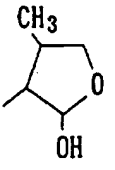
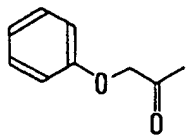
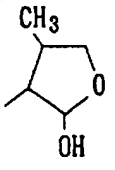
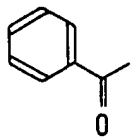
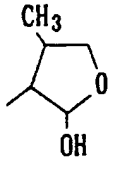
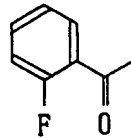
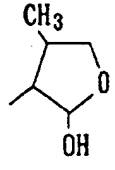
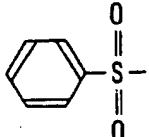
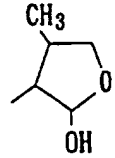
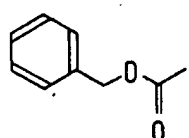

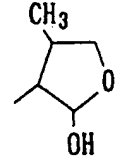
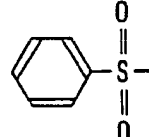

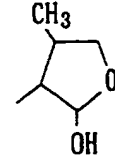
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
316		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
317		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
318		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
319		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
320		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
321		-H	-CH ₂ - 	-H	
322		-H	-CH ₂ - 	-H	

表 - 1 (つづき)

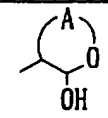
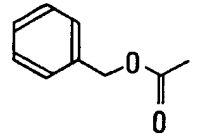
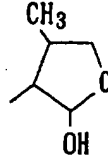
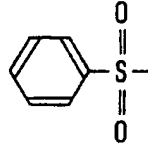
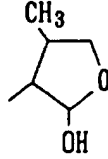
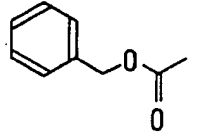
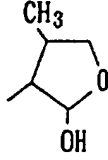
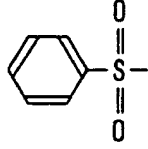
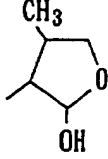
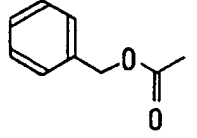
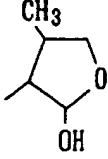
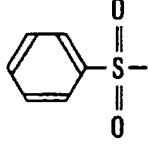
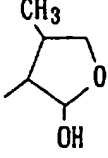
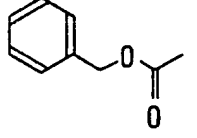

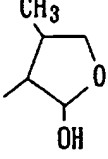
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
323		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
324		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
325		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
326		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
327		-H	-CH ₂ OH	-H	
328		-H	-CH ₂ OH	-H	
329		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

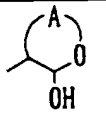
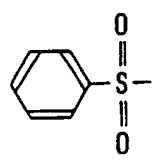
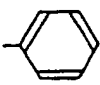
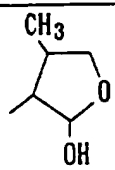
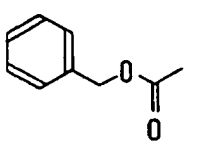
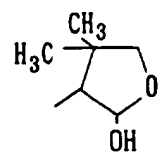
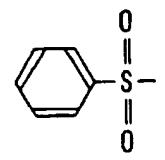
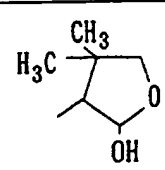
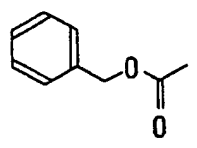
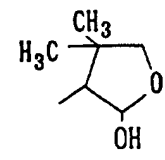
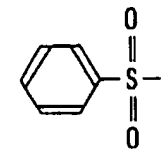
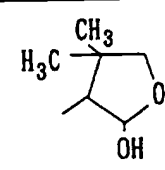
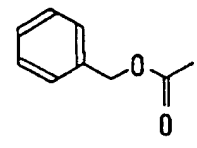
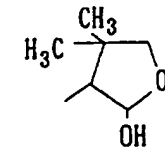
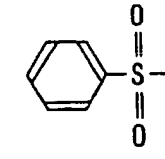
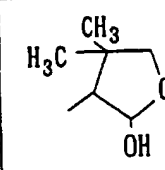
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
330		-H		-H	
331		-H	-H	-H	
332		-H	-H	-H	
333		-H	-CH ₃	-H	
334		-H	-CH ₃	-H	
335		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
336		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	

表 - 1 (つづき)

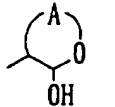
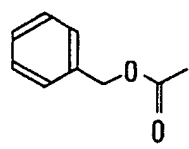
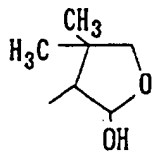
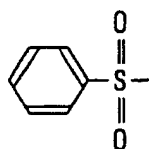
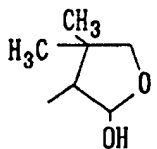
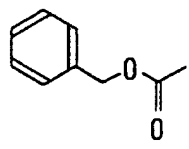
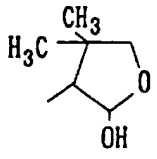
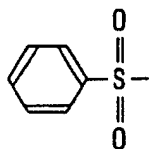
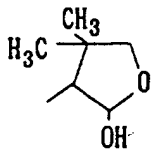
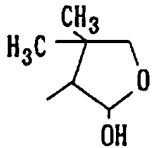
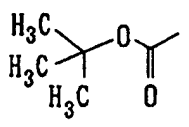
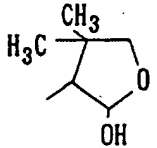
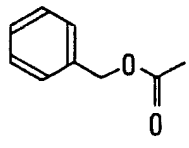
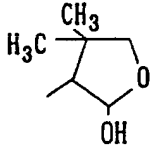
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
337		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
338		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
339		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
340		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
341	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
342		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
343		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

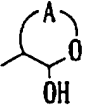
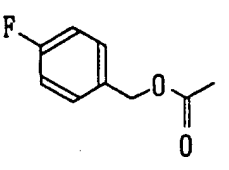
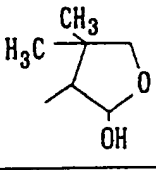
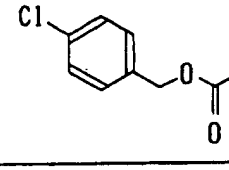
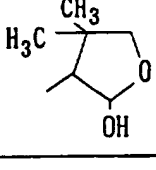
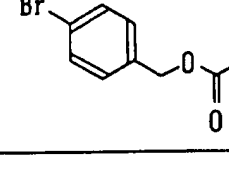
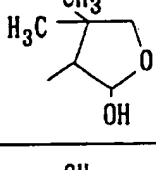
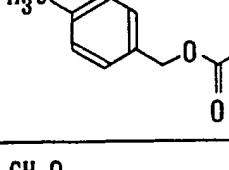
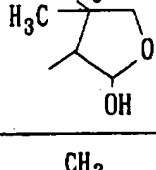
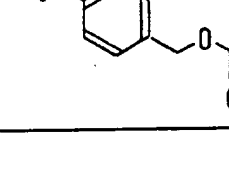
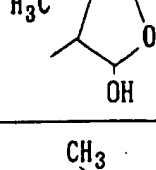

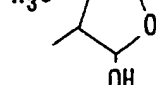
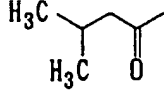
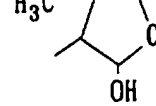
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
344		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
345		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
346		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
347		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
348		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
349		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
350		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

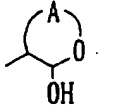
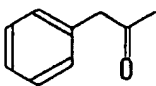
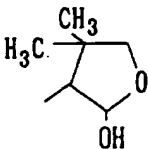
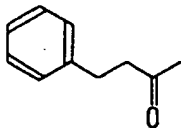
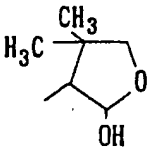
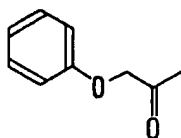
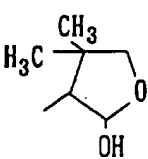
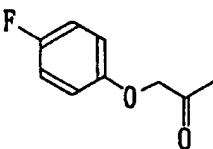
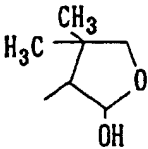
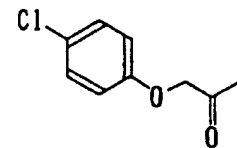
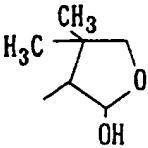
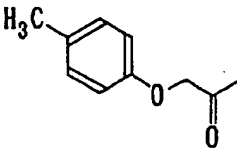
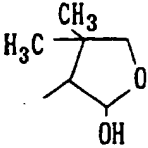
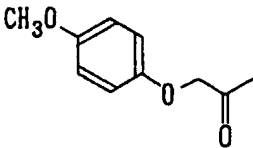
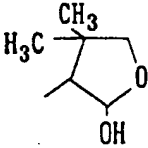
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
351		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
352		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
353		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
354		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
355		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
356		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
357		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

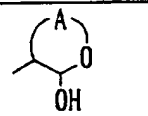
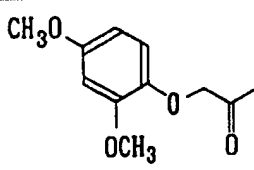
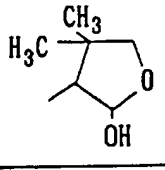
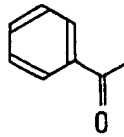
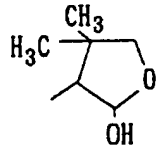
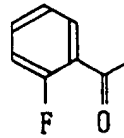
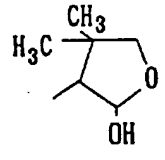
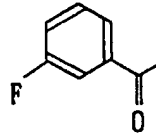
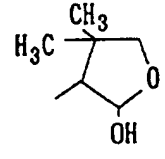
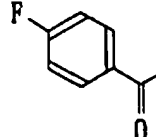
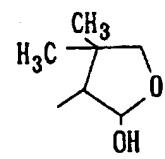
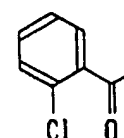
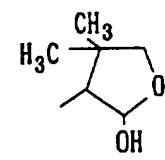
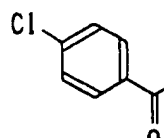
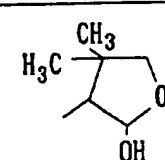
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
358		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
359		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
360		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
361		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
362		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
363		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
364		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

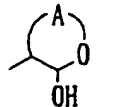
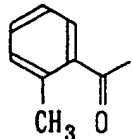
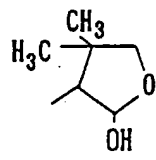
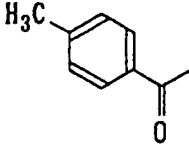
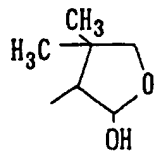
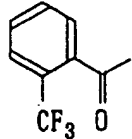
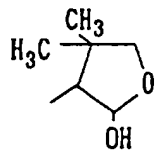
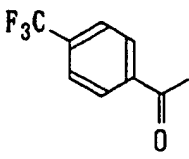
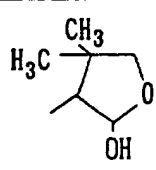
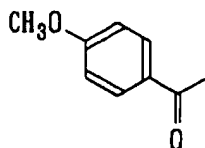
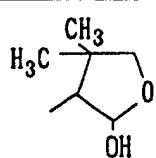
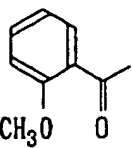
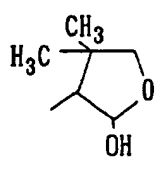
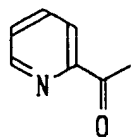
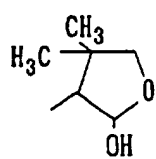
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
365		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
366		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
367		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
368		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
369		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
370		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
371		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

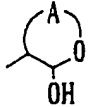
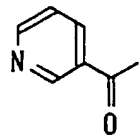
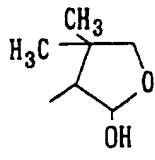
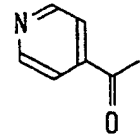
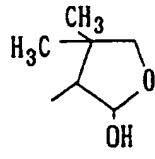
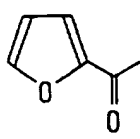
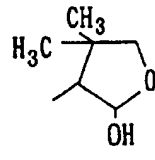
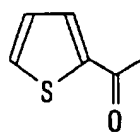
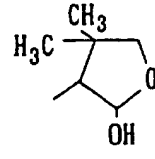
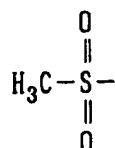
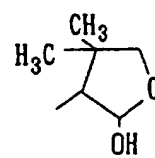
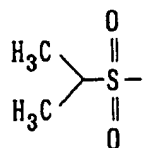
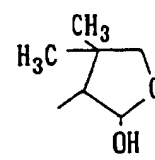
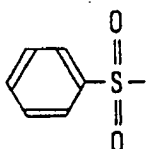
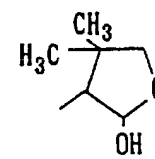
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
372		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
373		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
374		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
375		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
376		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
377		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
378		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

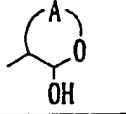
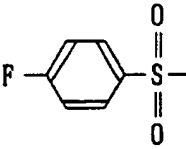
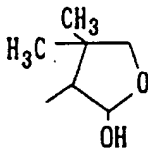
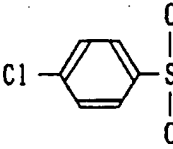
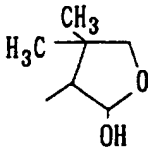
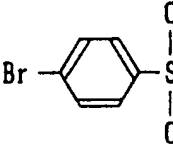
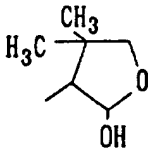
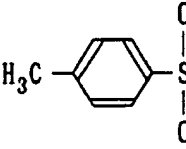
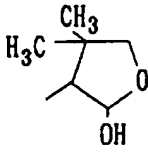
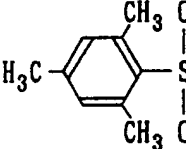
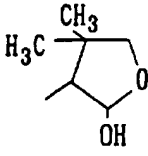
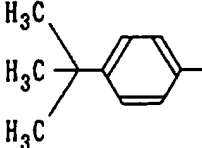
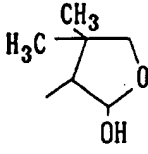
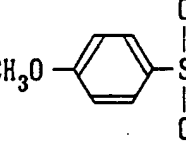
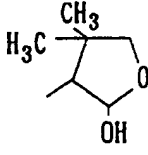
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
379		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
380		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
381		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
382		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
383		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
384		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
385		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

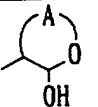
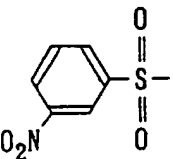
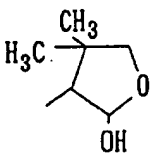
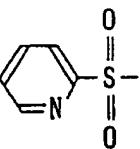
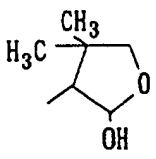
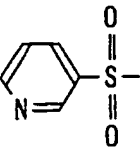
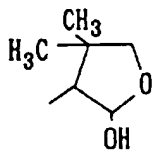
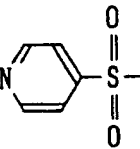
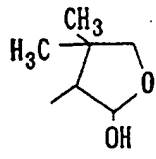
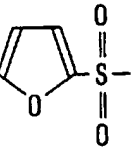
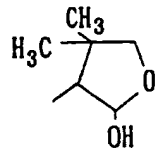

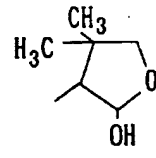
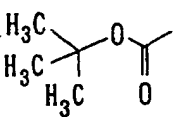

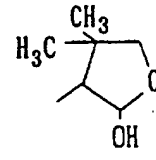
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
386		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
387		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
388		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
389		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
390		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
391	H-	-H	-CH ₂ - 	-H	
392		-H	-CH ₂ - 	-H	

表 - 1 (つづき)

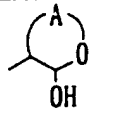
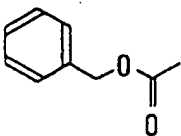
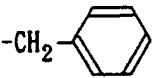
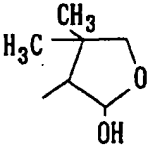
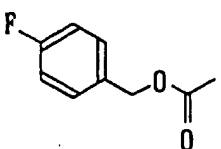
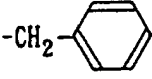
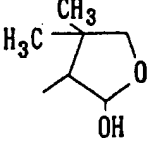
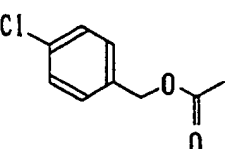
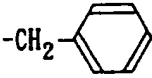
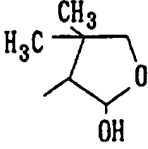
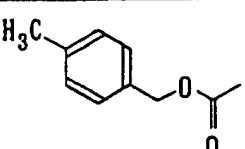
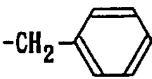
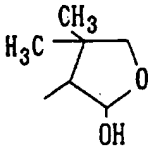
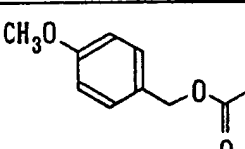
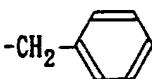
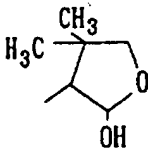
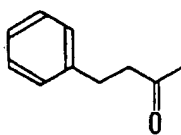
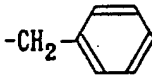
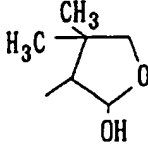
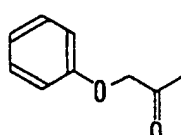
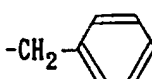
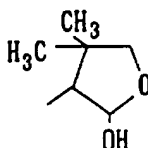
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
393		-H		-H	
394		-H		-H	
395		-H		-H	
396		-H		-H	
397		-H		-H	
398		-H		-H	
399		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
400		-H		-H	
401		-H		-H	
402		-H		-H	
403		-H		-H	
404		-H		-H	
405		-H		-H	
406		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

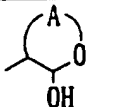
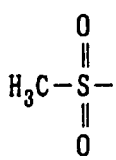
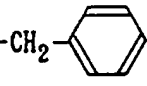
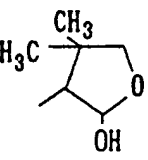
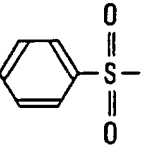
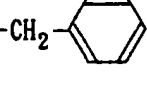
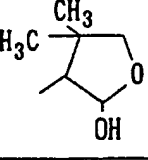
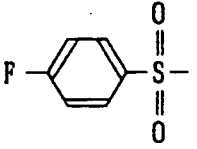
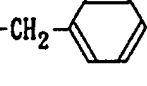
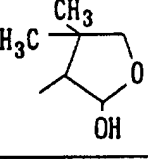
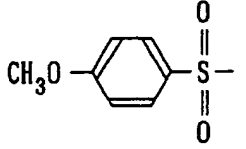
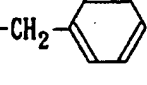
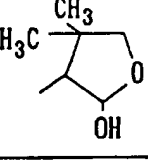
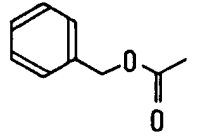
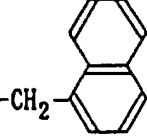
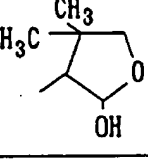
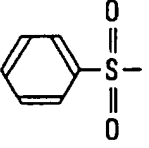
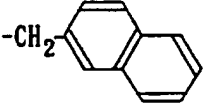
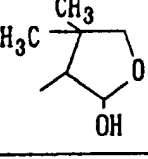
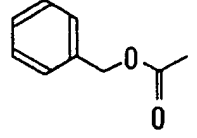
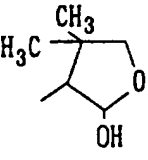
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
407		-H		-H	
408		-H		-H	
409		-H		-H	
410		-H		-H	
411		-H		-H	
412		-H		-H	
413		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	-H	

表 - 1 (つづき)

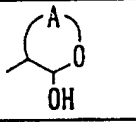
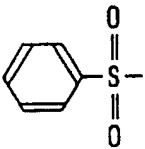
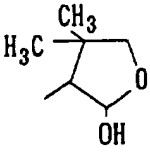
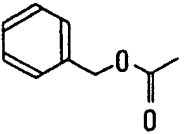
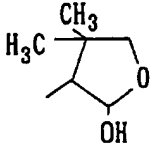
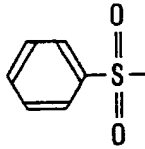
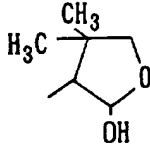
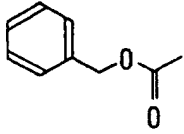
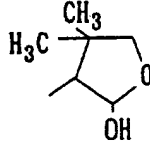
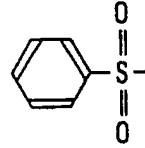
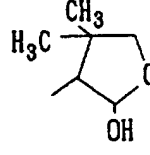
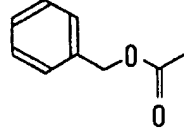
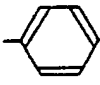
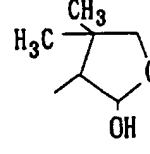
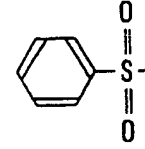
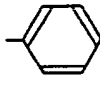
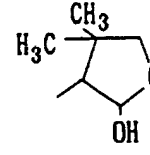
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
414		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
415		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
416		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
417		-H	-CH ₂ OH	-H	
418		-H	-CH ₂ OH	-H	
419		-H		-H	
420		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

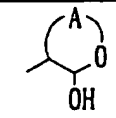
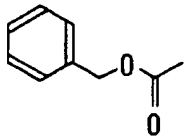
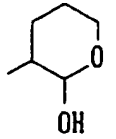
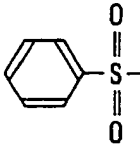
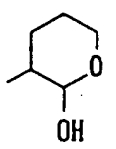
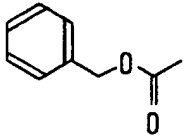
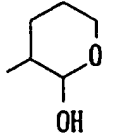
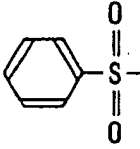
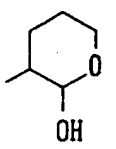
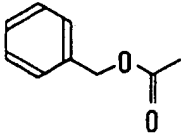
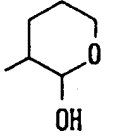
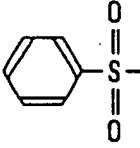
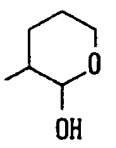
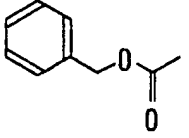
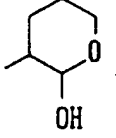
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
421		-H	-H	-H	
422		-H	-H	-H	
423		-H	-CH ₃	-H	
424		-H	-CH ₃	-H	
425		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
426		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
427		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

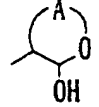
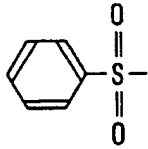
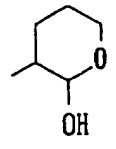
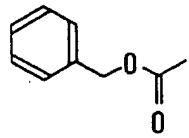
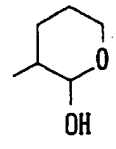
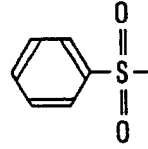
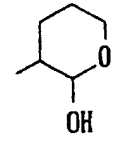
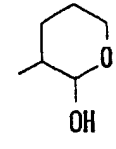
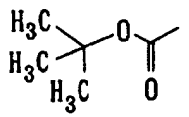
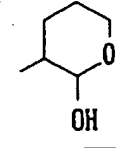
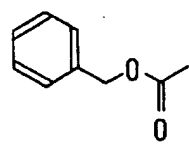
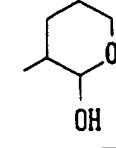
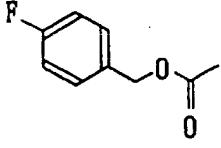
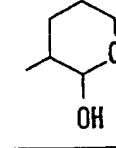
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
428		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
429		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
430		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
431	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
432		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
433		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
434		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

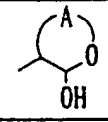
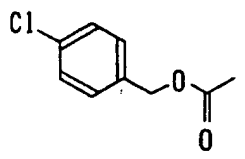
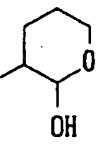
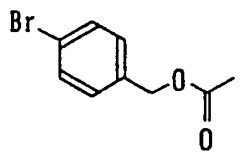
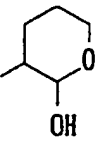
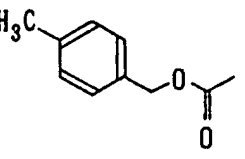
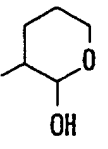
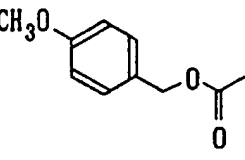
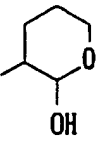
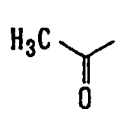
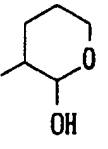
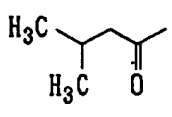
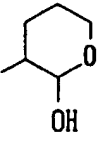
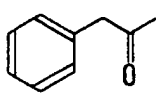
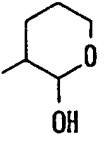
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
435		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
436		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
437		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
438		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
439		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
440		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
441		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

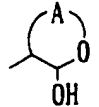
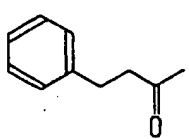
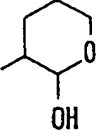
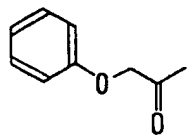
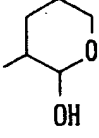
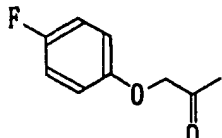
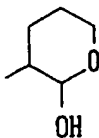
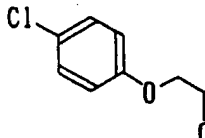
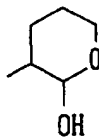
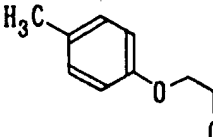
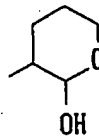
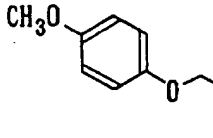
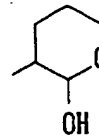
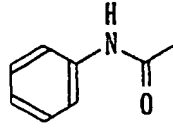
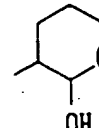
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
442		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
443		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
444		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
445		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
446		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
447		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
448		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

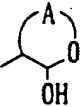
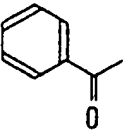
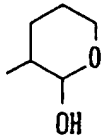
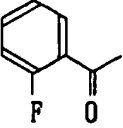
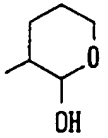
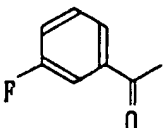
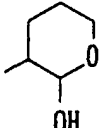
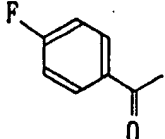
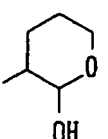
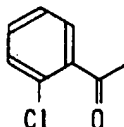
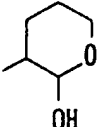
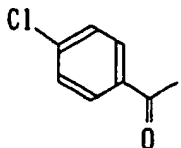
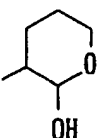
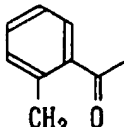
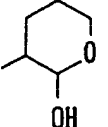
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
449		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
450		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
451		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
452		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
453		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
454		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
455		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

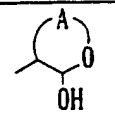
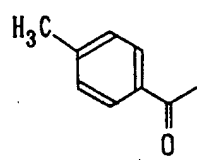
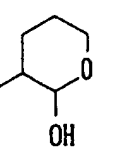
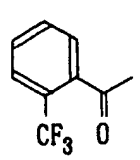
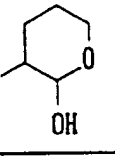
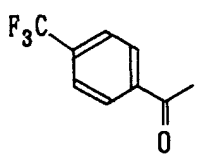
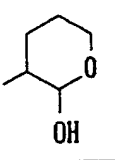
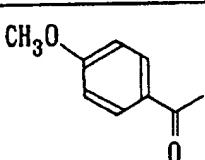
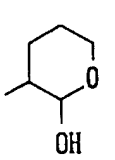
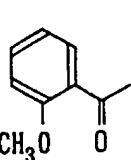
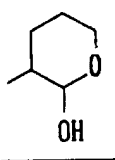
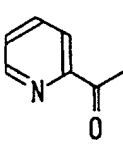
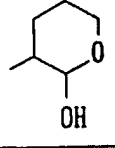
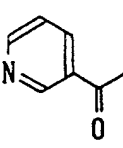
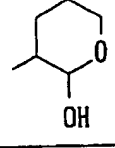
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
456		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
457		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
458		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
459		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
460		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
461		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
462		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

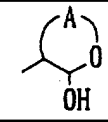
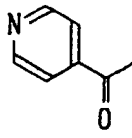
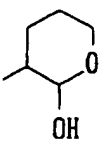
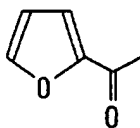
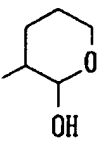
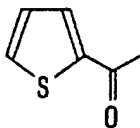
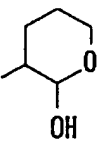
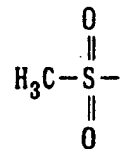
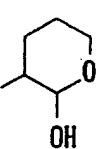
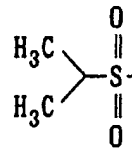
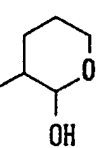
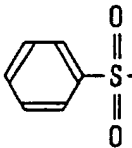
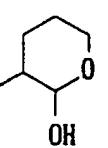
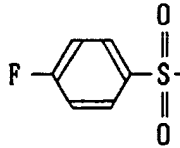
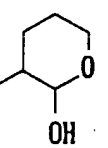
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
463		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
464		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
465		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
466		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
467		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
468		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
469		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

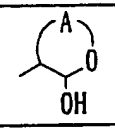
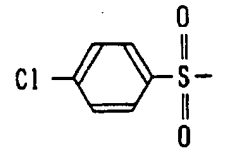
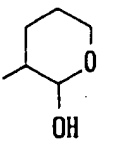
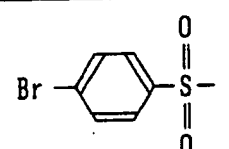
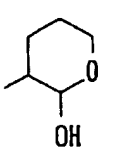
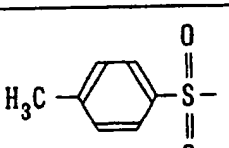
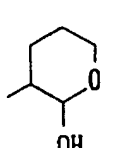
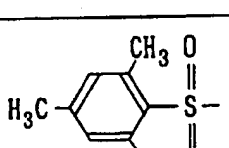
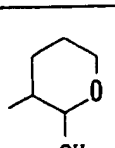
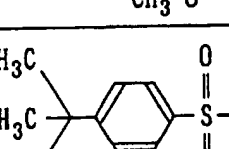
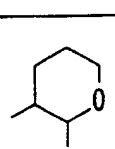
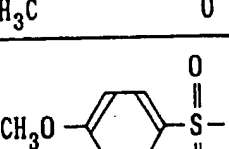
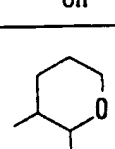
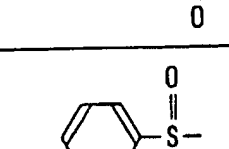
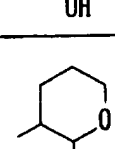
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
470		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
471		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
472		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
473		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
474		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
475		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
476		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 1 (つづき)

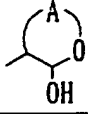
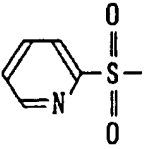
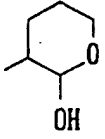
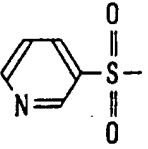
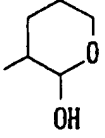
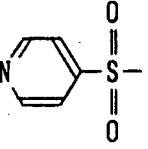
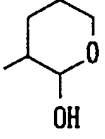
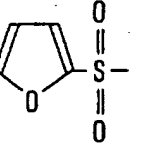
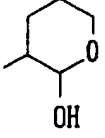

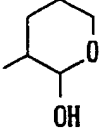
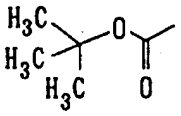

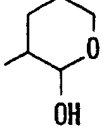
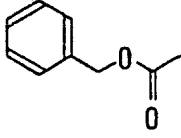

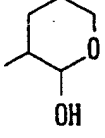
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
477		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
478		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
479		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
480		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
481	H-	-H	-CH ₂ - 	-H	
482		-H	-CH ₂ - 	-H	
483		-H	-CH ₂ - 	-H	

表 - 1 (つづき)

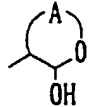
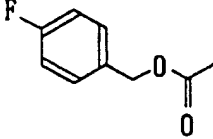
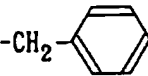
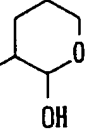
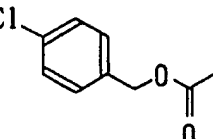
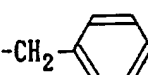
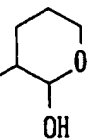
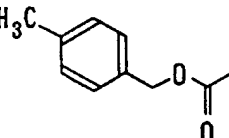
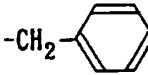
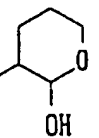
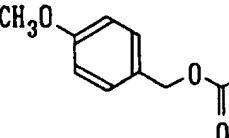
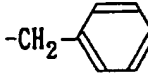
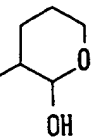
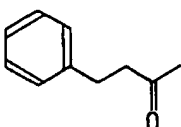
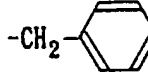
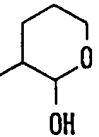
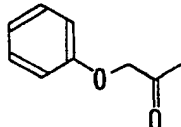
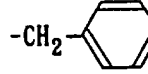
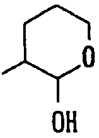
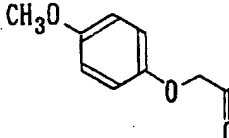
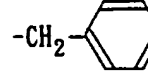
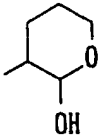
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
484		-H		-H	
485		-H		-H	
486		-H		-H	
487		-H		-H	
488		-H		-H	
489		-H		-H	
490		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

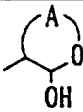
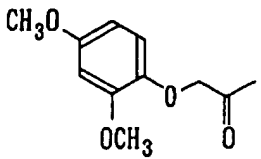
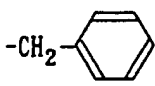
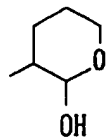
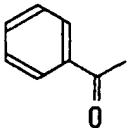
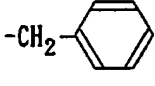
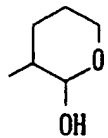
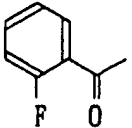
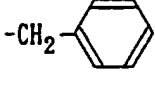
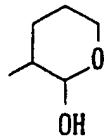
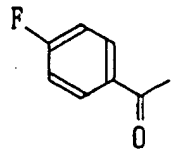
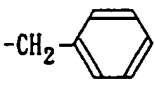
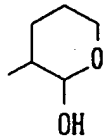
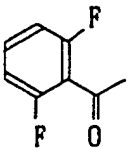
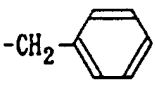
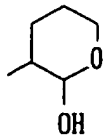
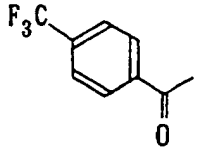
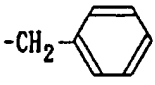
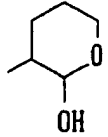
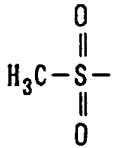
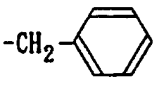
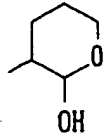
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
491		-H		-H	
492		-H		-H	
493		-H		-H	
494		-H		-H	
495		-H		-H	
496		-H		-H	
497		-H		-H	

表 - 1 (つづき)

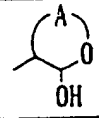
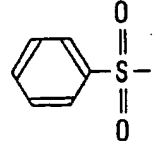
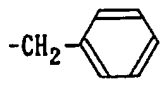
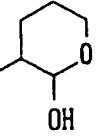
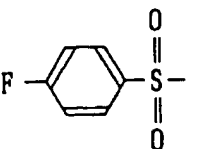
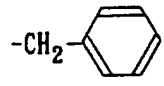
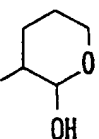
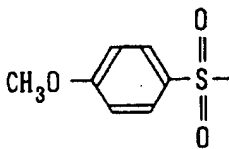
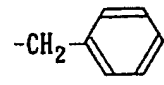
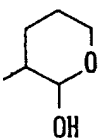
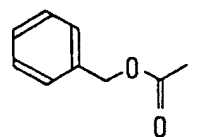
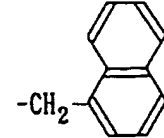
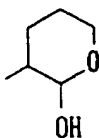
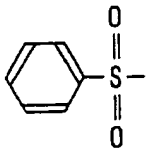
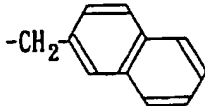
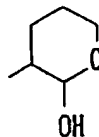
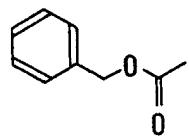
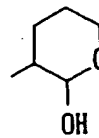
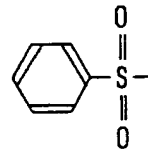
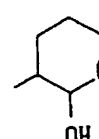
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
498		-H		-H	
499		-H		-H	
500		-H		-H	
501		-H		-H	
502		-H		-H	
503		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	-H	
504		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	-H	

表 - 1 (つづき)

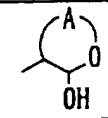
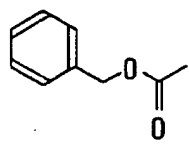
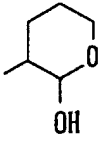
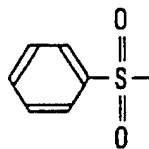
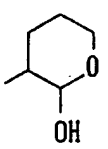
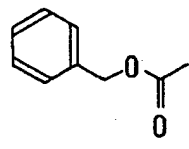
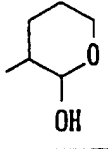
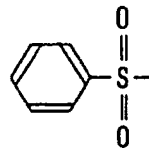
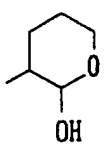
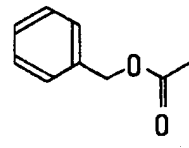

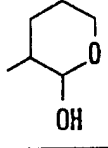
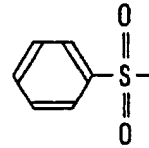

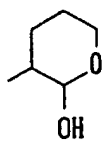
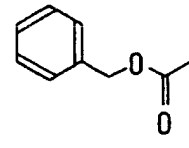
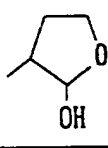
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
505		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
506		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	
507		-H	-CH ₂ OH	-H	
508		-H	-CH ₂ OH	-H	
509		-H		-H	
510		-H		-H	
511		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃ CO	

表 - 1 (つづき)

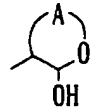
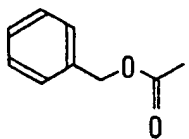
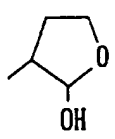
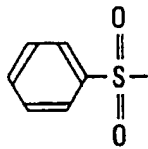
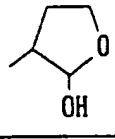
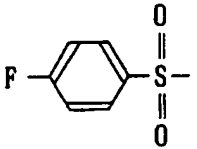
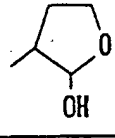
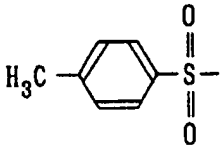
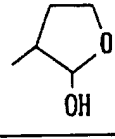
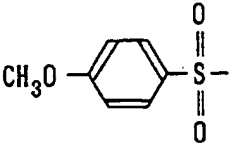
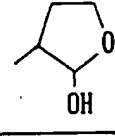
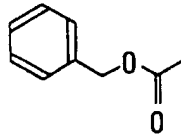

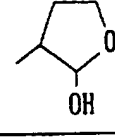
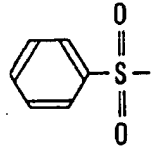

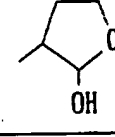
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
512		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
513		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
514		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
515		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
516		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
517		CH ₃ CO-	-CH ₂ - 	-H	
518		CH ₃ CO-	-CH ₂ - 	-H	

表 - 1 (つづき)

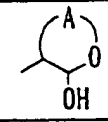
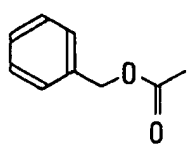
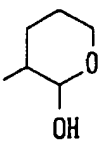
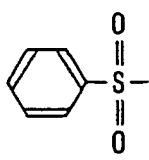
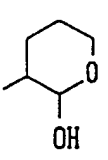
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
519		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
520		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 2 (n=0の場合)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
521		-H	-H	-H		
522		-H	-CH ₃	-H		
523		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
524		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

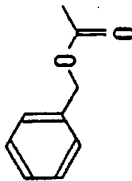
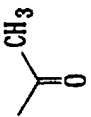
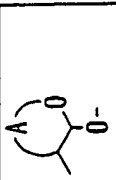
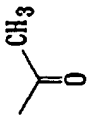
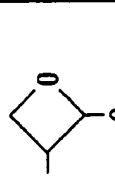
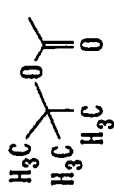
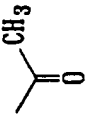
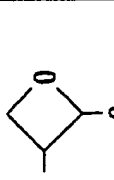
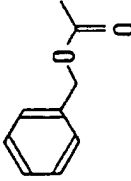
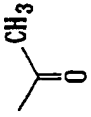
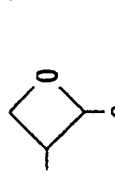
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
525		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
526	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
527		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
528		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

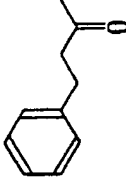
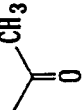
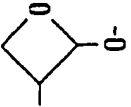
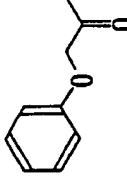
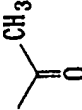
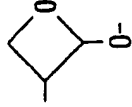
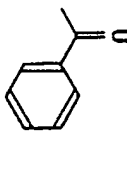
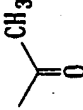
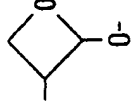
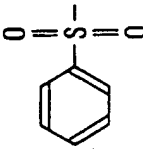
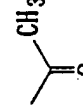
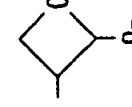
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
529		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
530		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
531		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
532		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
533		-H		-H		
534		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
535		-H	-CH ₂ OH	-H		
536		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
537		-H	-H	-H		
538		-H	-CH ₃	-H		
539		-H	-CH ₃	-H		
540		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

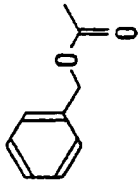
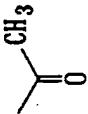
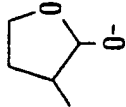
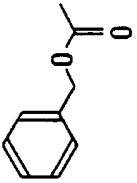
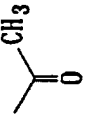
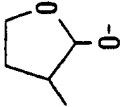
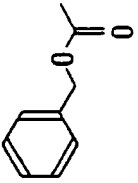
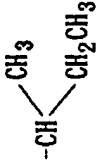
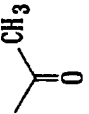
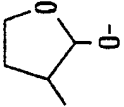
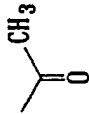
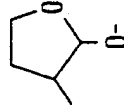
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
541		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
542		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
543		-H		-H		
544	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
545		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
546		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
547		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
548		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

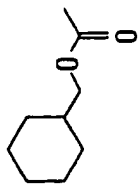
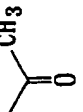
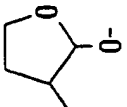
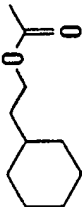
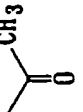
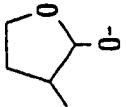
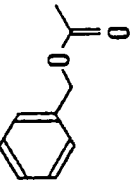
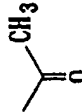
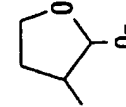
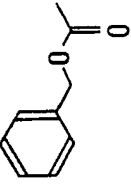
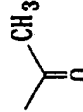
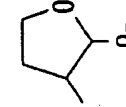
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
549		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
550		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
551		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
552		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
553		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃		
554		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃		
555		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
556		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

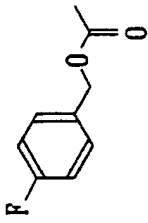
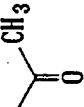
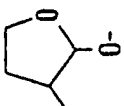
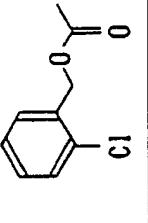
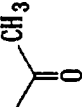
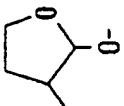
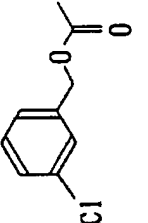
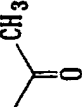
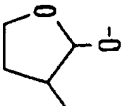
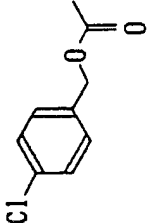
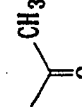
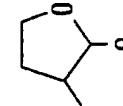
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
557		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
558		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
559		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
560		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
561		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
562		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
563		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
564		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
565		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
566		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
567		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
568		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
569		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
570		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
571		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
572		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

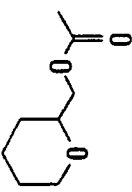
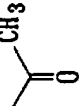
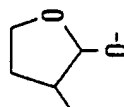
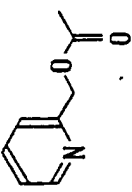
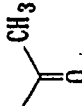
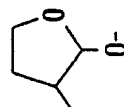
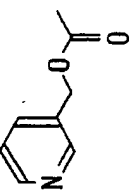
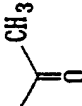
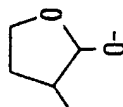
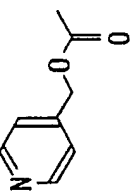
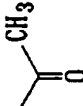
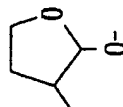
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
573		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
574		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
575		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
576		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
577		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
578		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
579		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
580		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)


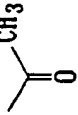
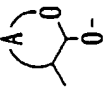
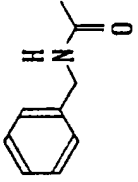
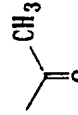
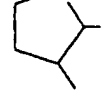
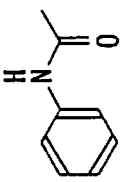
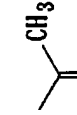
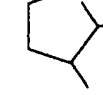
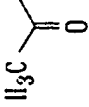
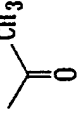
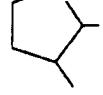
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
581		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
582		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
583		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
584		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

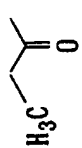
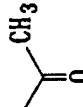
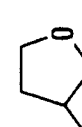
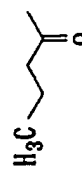
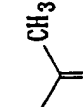
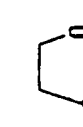
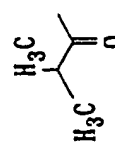
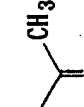
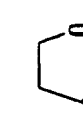

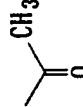
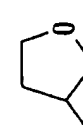
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
585		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
586		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
587		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
588		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

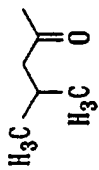
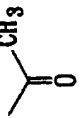

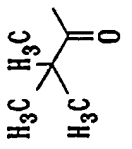
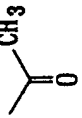
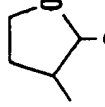

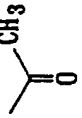
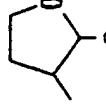
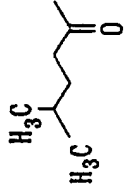
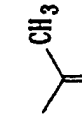
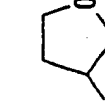
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
589		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
590		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
591		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
592		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
593		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
594		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
595		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
596		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
597		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
598		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
599		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
600		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
601		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
602		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
603		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
604		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

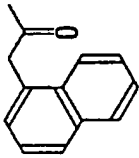

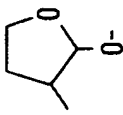
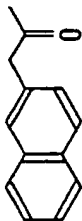

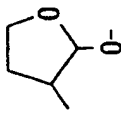
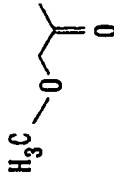

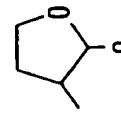
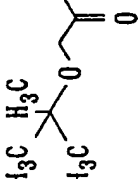

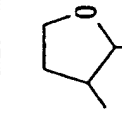
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
605		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
606		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
607		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
608		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
609		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
610		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
611		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
612		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

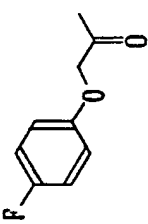
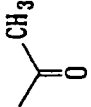
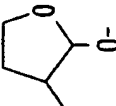
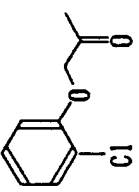
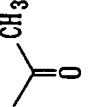
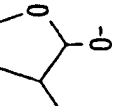
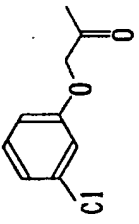
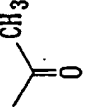
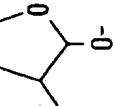
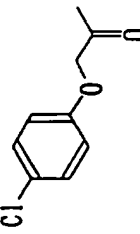
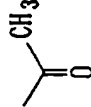
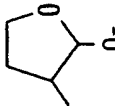
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
613		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
614		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
615		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
616		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
617		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
618		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
619		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
620		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

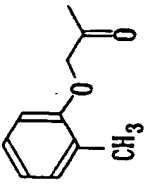
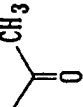
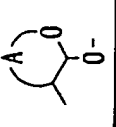
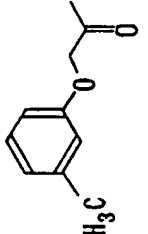
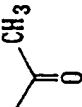
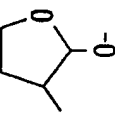
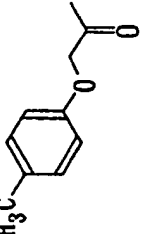
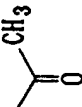
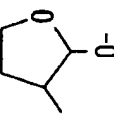
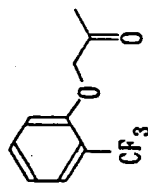
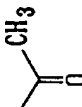
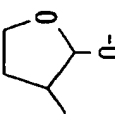
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
621		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
622		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
623		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
624		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
625		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
626		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
627		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
628		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
629		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
630		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
631		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
632		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

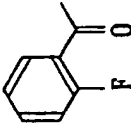
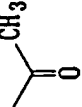
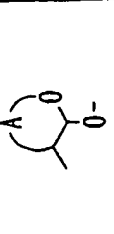
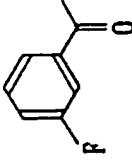
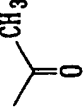
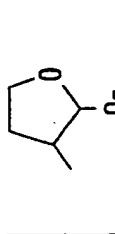
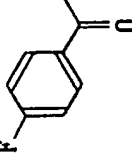
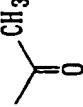
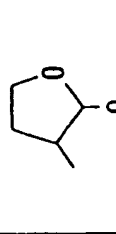
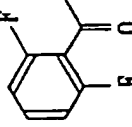
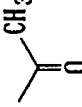
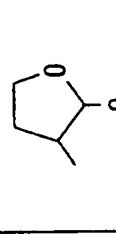
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
633		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
634		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
635		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
636		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

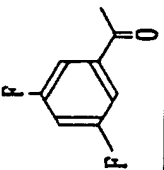
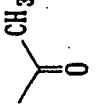
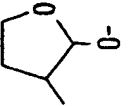
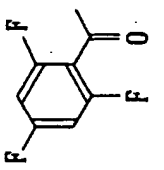
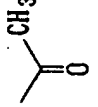
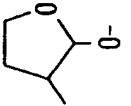
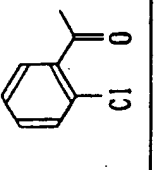
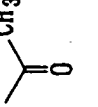
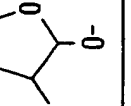
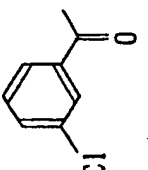
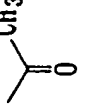
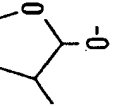
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
637		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
638		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
639		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
640		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

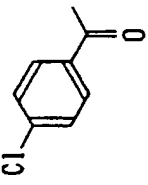
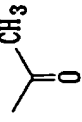
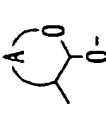
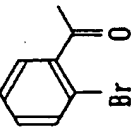
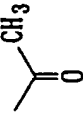
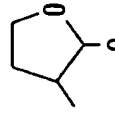
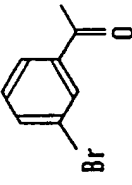
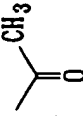
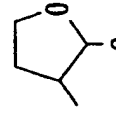
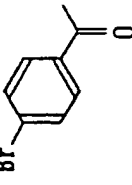
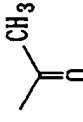
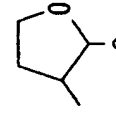
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
641		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
642		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
643		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
644		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

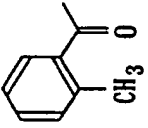
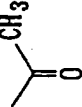
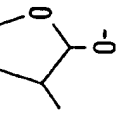
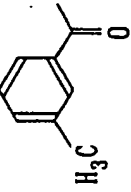
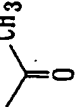
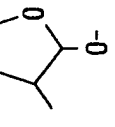
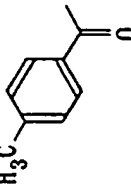
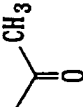
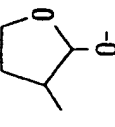
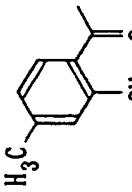
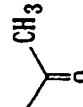
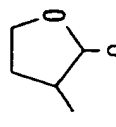
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
645		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
646		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
647		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
648		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
649		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
650		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
651		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
652		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

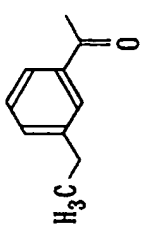
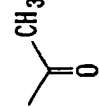
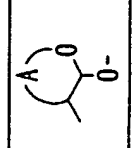
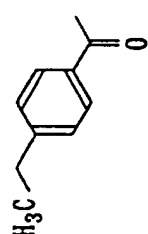
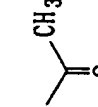
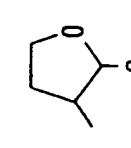
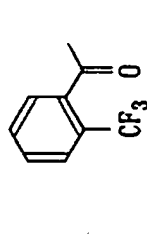
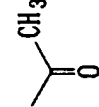
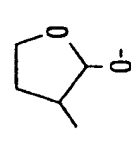
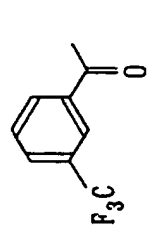
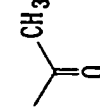
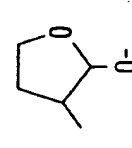
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
653		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
654		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
655		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
656		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

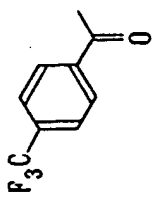
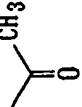

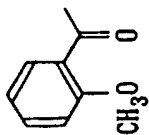
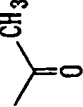
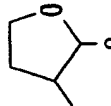
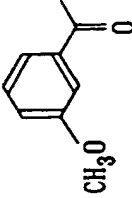
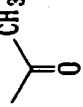
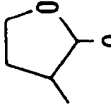
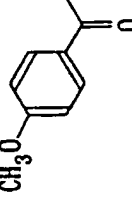
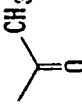
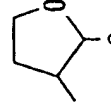
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
657		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
658		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
659		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
660		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
661		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
662		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
663		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
664		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
665		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
666		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
667		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
668		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
669		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
670		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
671		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
672		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
673		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
674		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
675		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
676		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
677		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
678		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
679		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
680		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

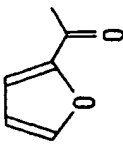
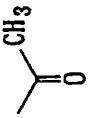
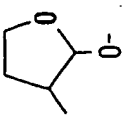
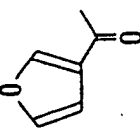
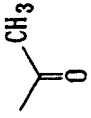
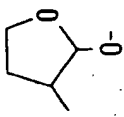
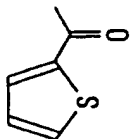
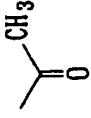
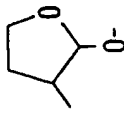
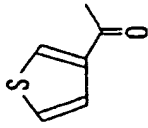
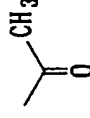
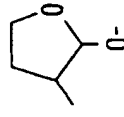
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
681		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
682		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
683		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
684		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

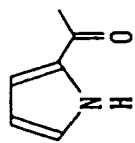
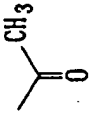
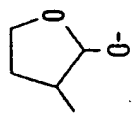
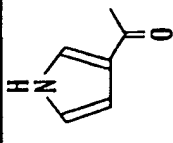
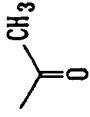
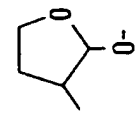
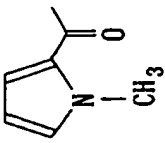
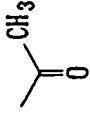
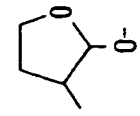
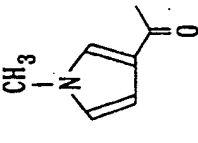
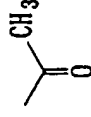
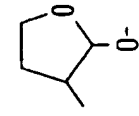
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
685		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
686		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
687		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
688		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
689		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
690		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
691		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
692		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

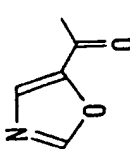
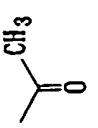
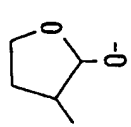
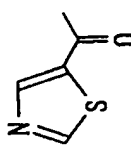
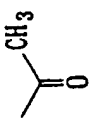
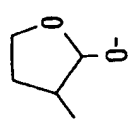
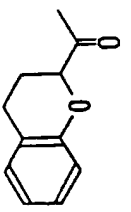
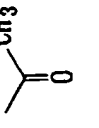
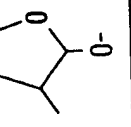
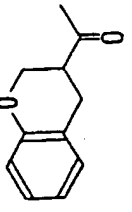
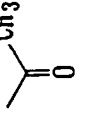
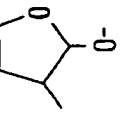
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
693		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
694		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
695		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
696		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

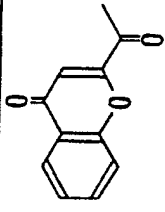
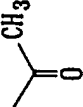
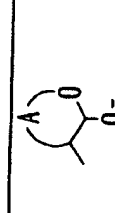
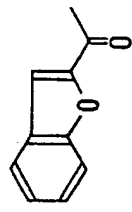
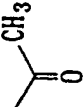
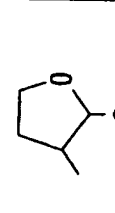
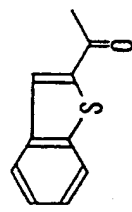
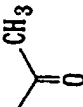
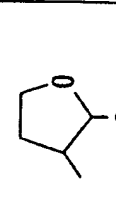
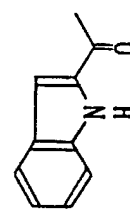
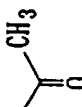
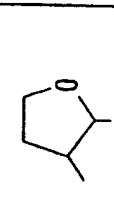
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
697		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
698		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
699		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
700		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

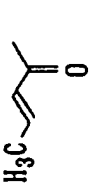
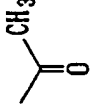
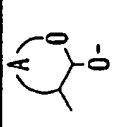
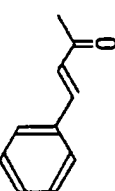
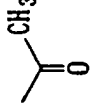
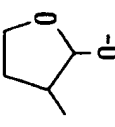
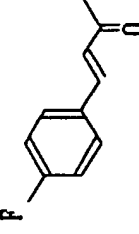
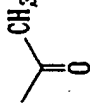
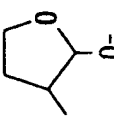
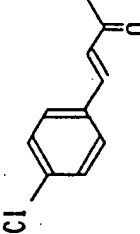
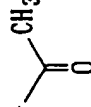
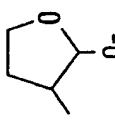
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
701		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
702		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
703		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
704		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
705		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
706		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
707		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
708		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
709		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
710		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
711		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
712		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

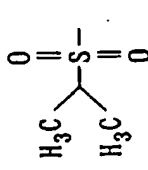
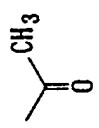
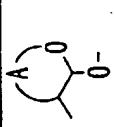
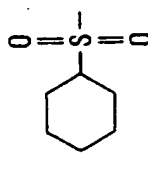
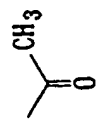
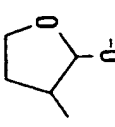
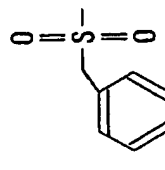
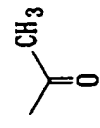
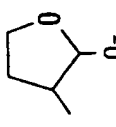
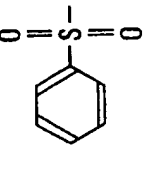
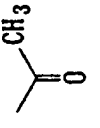
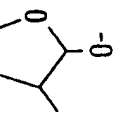
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
713		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
714		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
715		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
716		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

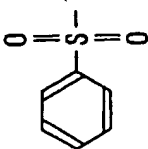
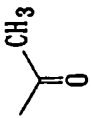
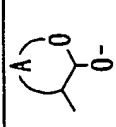
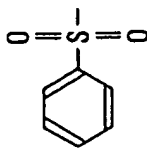
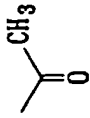
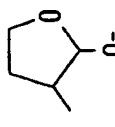
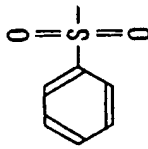
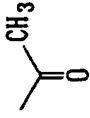
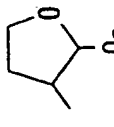
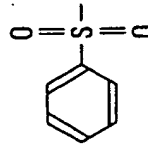
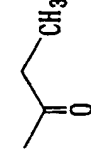
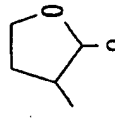
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
717		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
718		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃		
719		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃		
720		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

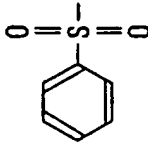
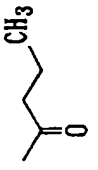
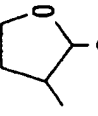
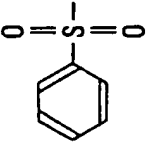
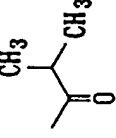
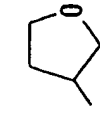
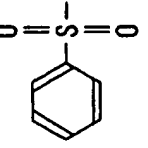

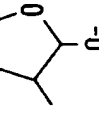
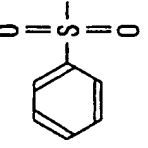
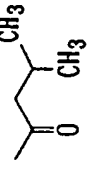
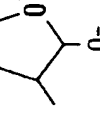
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
721		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
722		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
723		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
724		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

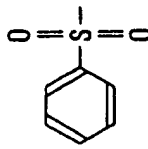
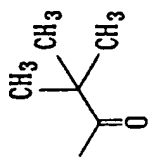
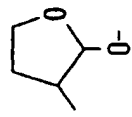
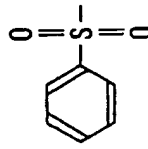
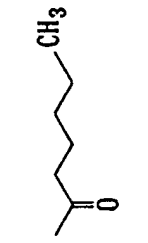
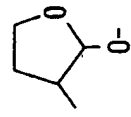
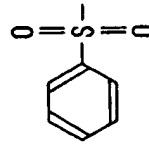
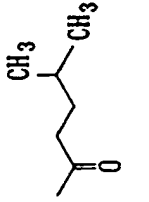
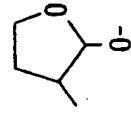
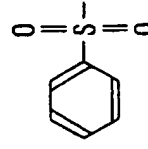
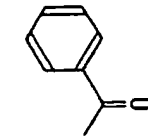
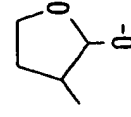
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
725		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
726		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
727		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
728		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

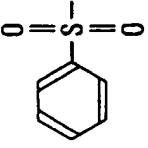
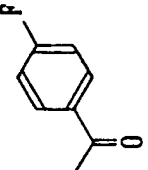
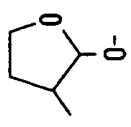
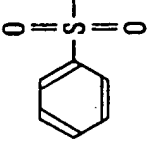
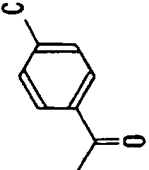
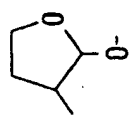
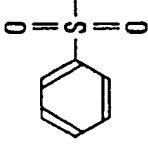
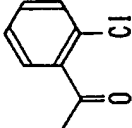
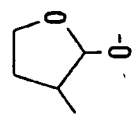
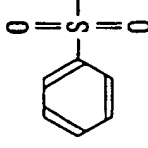
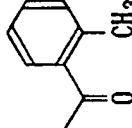
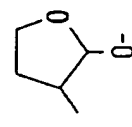
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
729		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
730		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
731		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
732		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

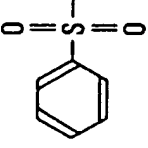
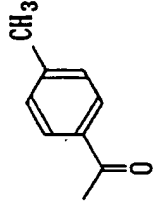
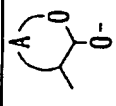
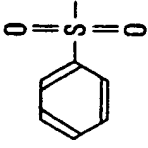
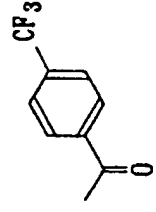
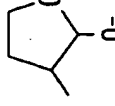
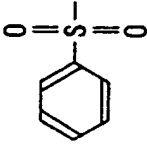
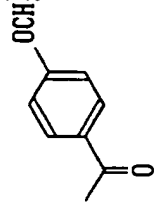
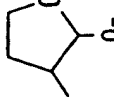
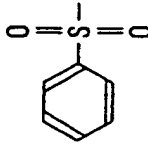
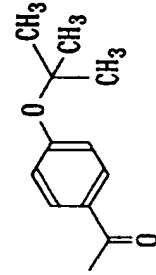
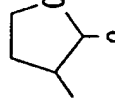
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
733		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
734		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
735		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
736		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

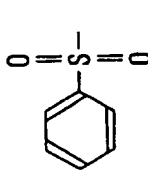
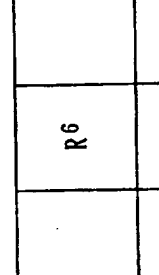

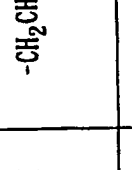
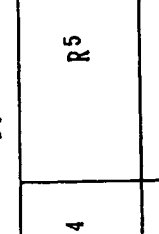

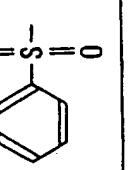
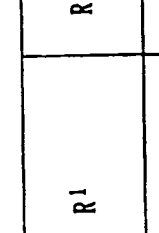

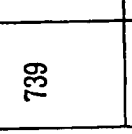
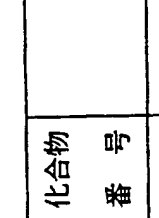

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
737		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
738		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
739		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
740		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

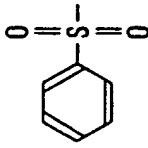
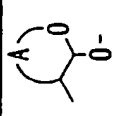
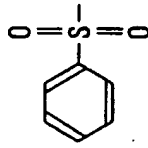
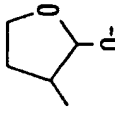
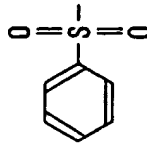
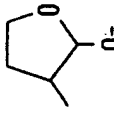
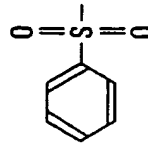
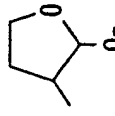
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
741		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	
742		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₃	
743		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	
744		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	

表 - 2 (つづき)

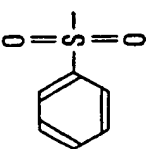
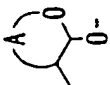
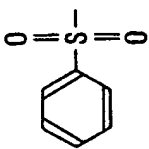
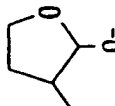
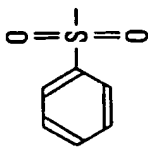
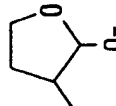
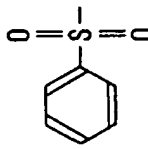
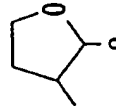
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
745		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	
746		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	
747		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-C(CH ₃) ₃	
748		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	

表 - 2 (つづき)

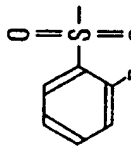
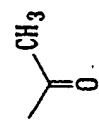
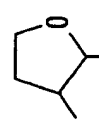
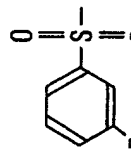
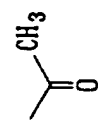
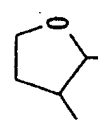
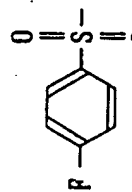
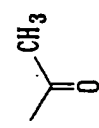
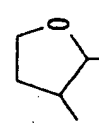
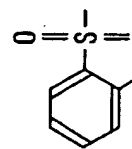
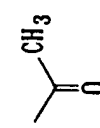
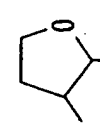
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
749		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
750		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
751		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
752		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
753		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
754		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
755		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
756		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

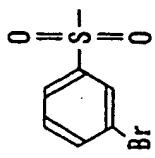
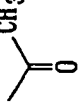
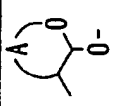
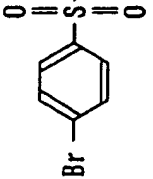
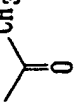
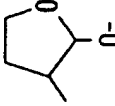
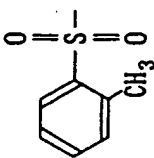
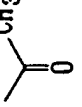
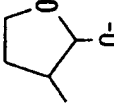
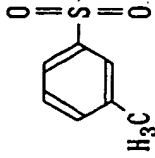
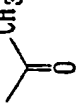
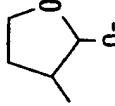
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
757		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
758		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
759		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
760		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
761		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
762		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
763		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
764		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
765		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
766		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
767		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
768		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

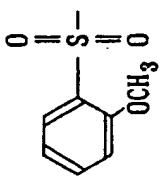
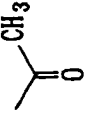
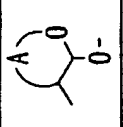
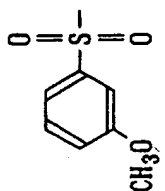
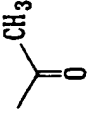
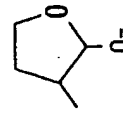
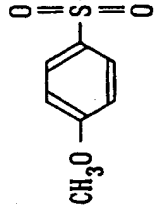
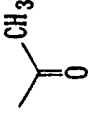
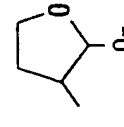
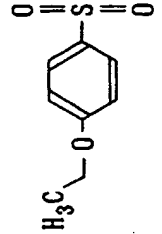
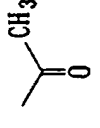
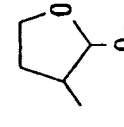
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
769		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
770		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
771		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
772		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
773		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
774		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
775		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
776		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

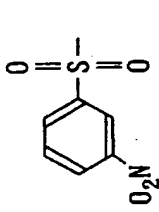
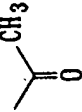
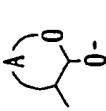
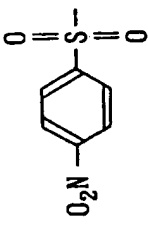
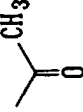
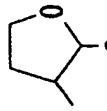
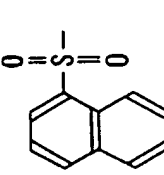
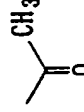
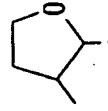
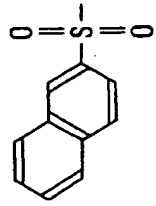
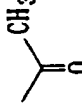
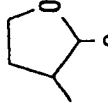
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
777		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
778		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
779		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
780		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

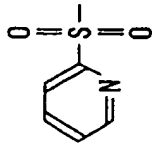
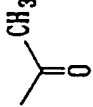
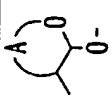
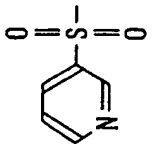
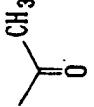
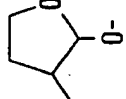
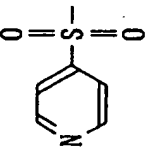
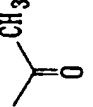
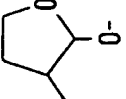
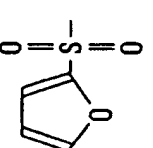
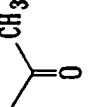
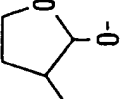
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
781		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
782		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
783		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
784		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

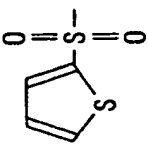
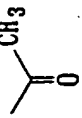
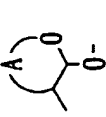
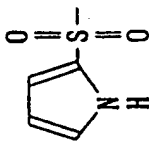
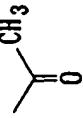
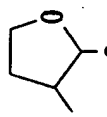
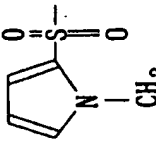
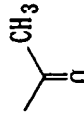
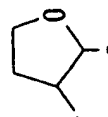
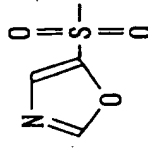
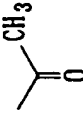
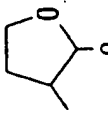
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	A
785		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
786		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
787		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
788		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		

表 - 2 (つづき)

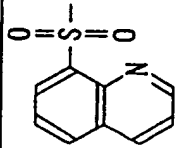
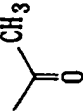
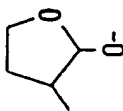
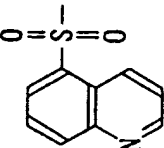
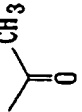
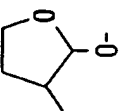
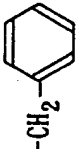
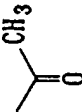
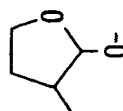

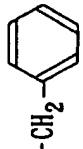
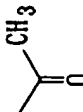
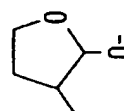
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
789		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
790		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
791	H-	-H		-H		
792		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

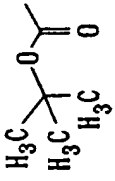
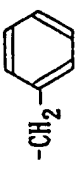
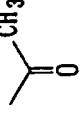
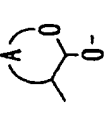
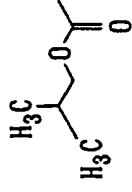
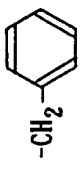
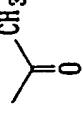
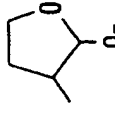
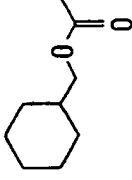
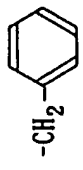
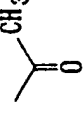
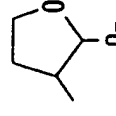
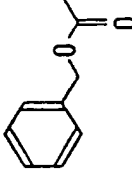
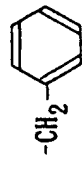
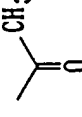
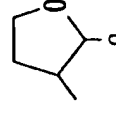
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
793		-H		-H		
794		-H		-H		
795		-H		-H		
796		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

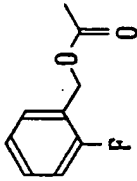
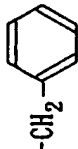
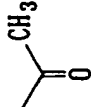
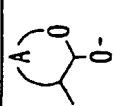
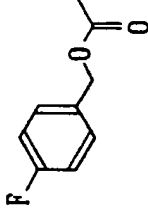
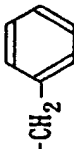
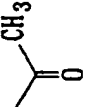
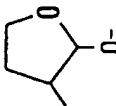
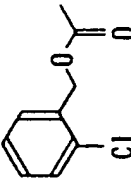
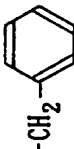
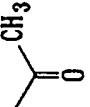
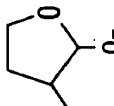
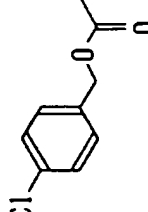
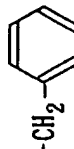
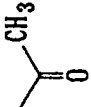
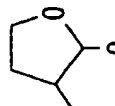
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
797		-H		-H		
798		-H		-H		
799		-H		-H		
800		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
801		-H		-H		
802		-H		-H		
803		-H		-H		
804		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
805		-H		-H		
806		-H		-H		
807		-H		-H		
808		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
809		-H		-H		
810		-H		-H		
811		-H		-H		
812		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
813		-H		-H		
814		-H		-H		
815		-H		-H		
816		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

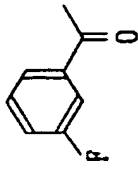
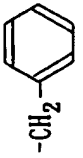
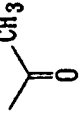
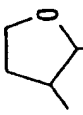
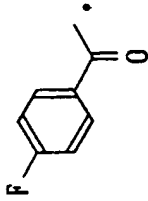
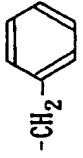
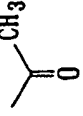
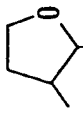
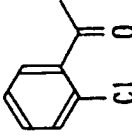
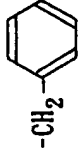
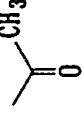
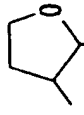
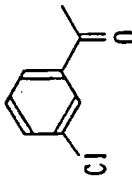
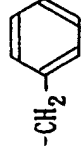
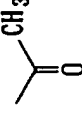
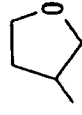
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
817		-H		-H		
818		-H		-H		
819		-H		-H		
820		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
821		-H		-H		
822		-H		-H		
823		-H		-H		
824		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
825		-H		-H		
826		-H		-H		
827		-H		-H		
828		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

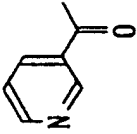
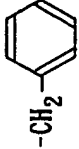
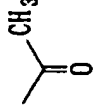
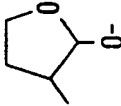
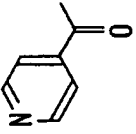
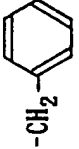
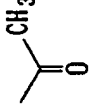
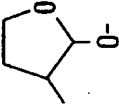
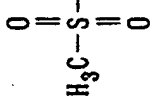
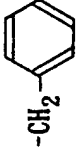
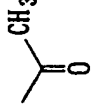
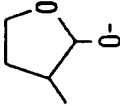
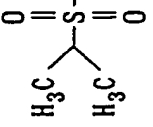
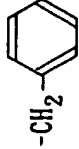
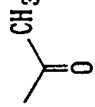
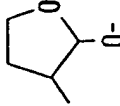
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
829		-H		-H		
830		-H		-H		
831		-H		-H		
832		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

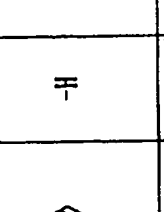
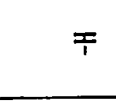



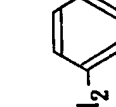
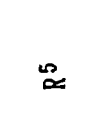
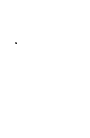

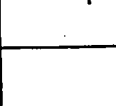
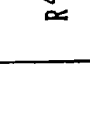


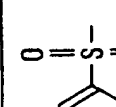


化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
833		-H		-H		
834		-H		-H		
835		-H		-H		
836		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
837		-H		-H		
838		-H		-H		
839		-H		-H		
840		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
841		-H		-H		
842		-H		-H		
843		-H		-H		
844		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
845		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
846		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
847		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		
848		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
849		-H		-H		
850		-H		-H		
851		-H	-CH2OH	-H		
852		-H	-CH2OH	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
853		-H	-H	-H		
854		-H	-H	-H		
855		-H	-CH ₃	-H		
856		-H	-CH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
857		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
858		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
859		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
860		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

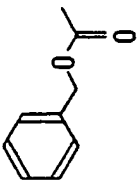
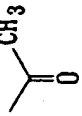
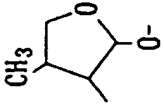
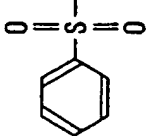
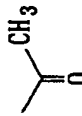
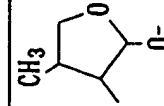
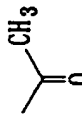
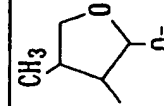
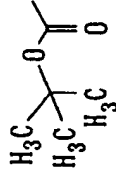
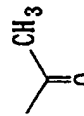
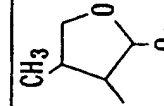
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
861		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
862		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
863	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
864		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
865		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
866		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
867		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
868		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
869		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
870		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
871		-H		-H		
872		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
873		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
874		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
875		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		
876		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
877		-H	-CH ₂ OH	-H		
878		-H	-CH ₂ OH	-H		
879		-H		-H		
880		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
881		-H	-H	-H		
882		-H	-H	-H		
883		-H	-CH ₃	-H		
884		-H	-CH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
885		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
886		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
887		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
888		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
889		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
890		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
891	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
892		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

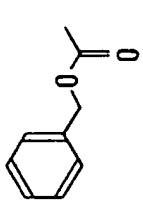
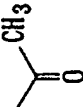
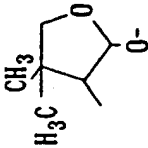
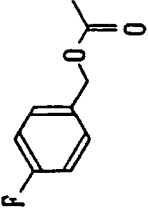
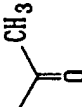
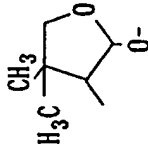
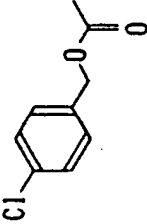
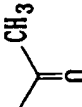
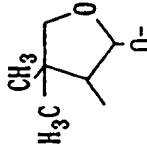
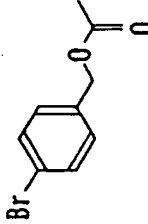
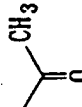
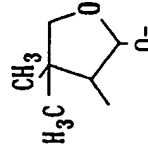
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
893		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
894		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
895		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
896		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
897		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
898		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
899		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
900		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
901		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
902		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
903		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
904		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
905		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
906		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
907		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
908		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

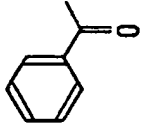
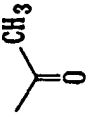
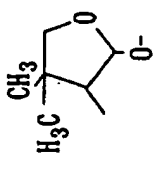
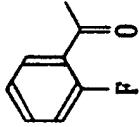
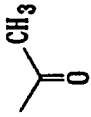
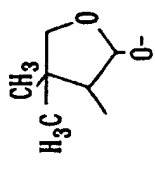
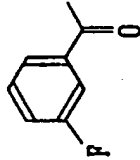
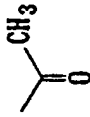
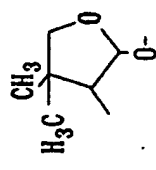
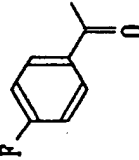
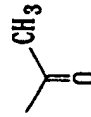
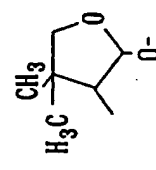
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
909		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
910		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
911		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
912		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

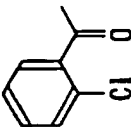
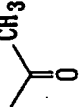
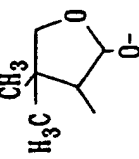
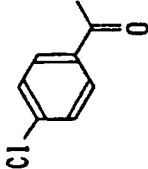
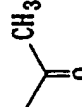
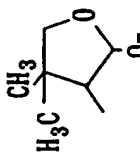
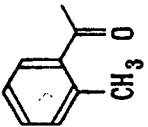
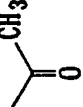
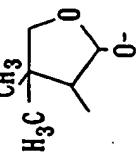
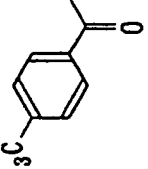
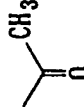
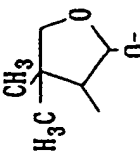
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
913		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
914		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
915		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		
916		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		

表 - 2 (つづき)

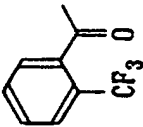
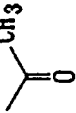
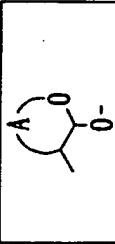
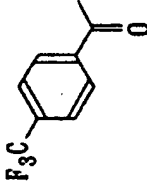
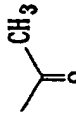
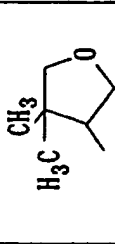
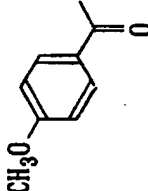
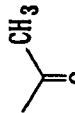
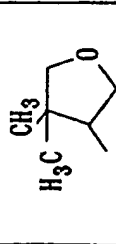
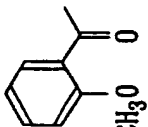
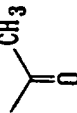
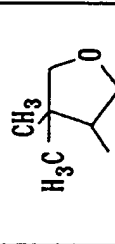
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
917		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
918		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
919		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
920		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

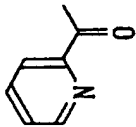
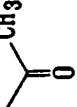
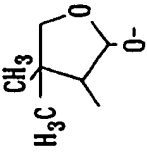
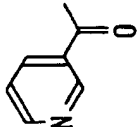
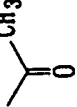
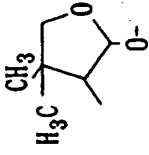
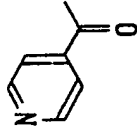
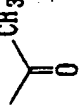
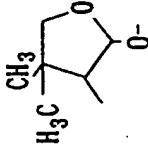
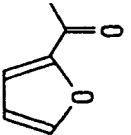
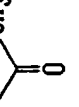
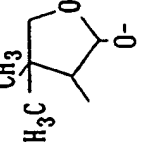
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
921		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
922		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
923		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
924		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

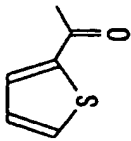
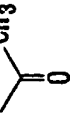
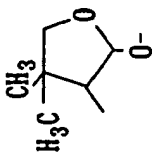
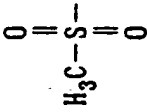
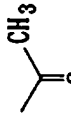
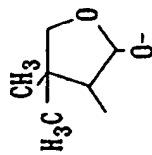
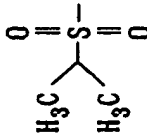
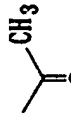
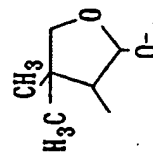
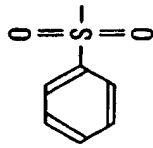
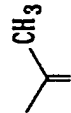
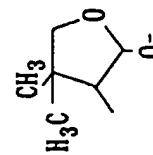
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
925		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
926		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
927		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
928		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

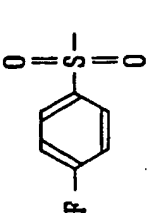
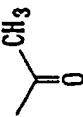
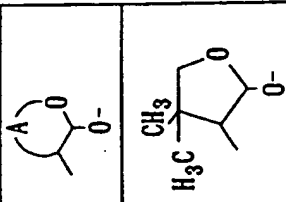
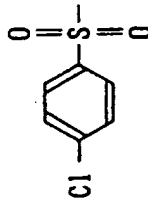
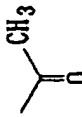
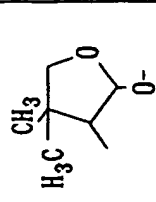
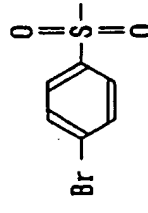
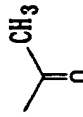
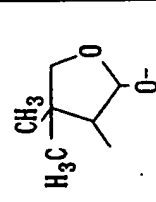
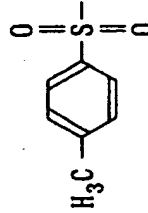
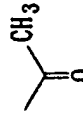
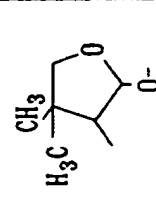
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
929		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
930		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
931		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
932		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
933		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
934		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
935		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
936		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

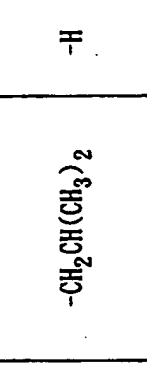
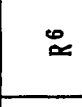




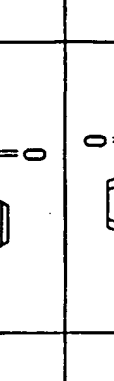
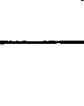



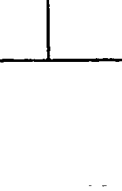
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
937		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
938		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
939		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
940		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

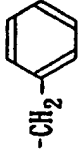
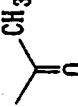
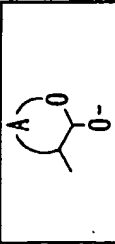
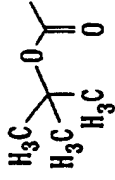
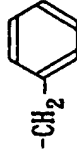
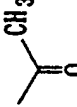
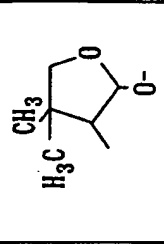
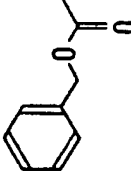
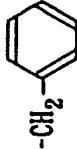
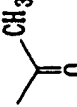
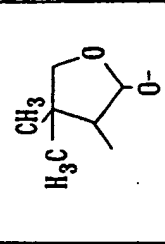
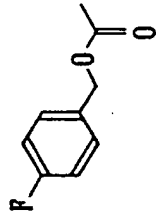
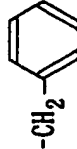
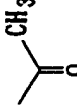
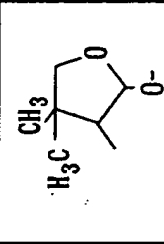
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
941	H-	-H		-H		
942		-H		-H		
943		-H		-H		
944		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

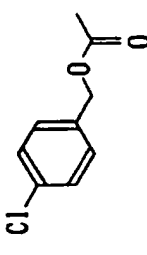
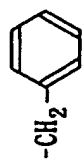
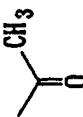
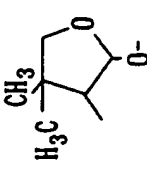
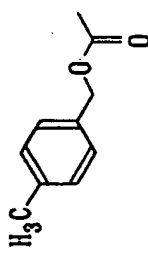
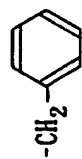
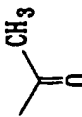
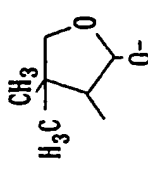
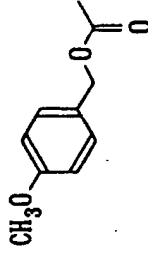
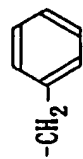
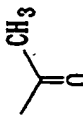
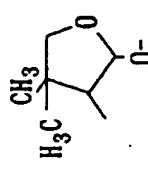
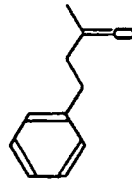
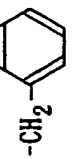
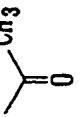
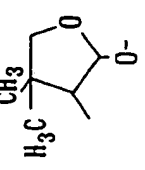
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
945		-H		-H		
946		-H		-H		
947		-H		-H		
948		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
949		-H		-H		
950		-H		-H		
951		-H		-H		
952		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
953		-H		-H		
954		-H		-H		
955		-H		-H		
956		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
957		-H		-H		
958		-H		-H		
959		-H		-H		
960		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
961		-H		-H		
962		-H		-H		
963		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
964		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
965		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		
966		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		
967		-H	-CH ₂ OH	-H		
968		-H	-CH ₂ OH	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
969		-H		-H		
970		-H		-H		
971		-H	-H	-H		
972		-H	-H	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
973		-H	-CH ₃	-H		
974		-H	-CH ₃	-H		
975		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
976		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

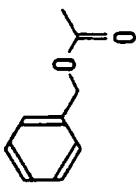
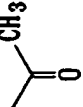
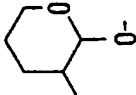
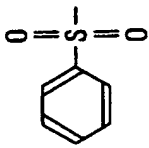
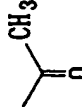
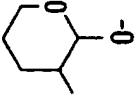
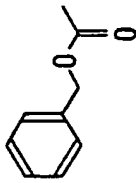
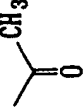
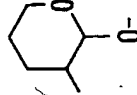
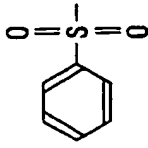
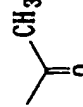
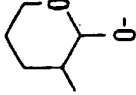
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
977		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
978		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
979		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
980		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

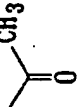
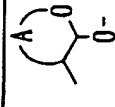
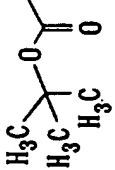
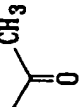
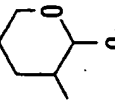
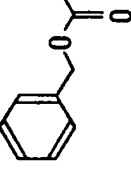
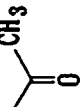
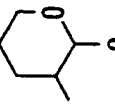
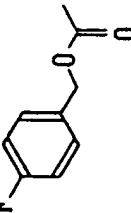
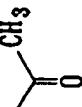
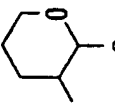
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
981	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
982		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
983		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
984		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
985		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
986		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
987		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
988		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
989		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
990		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
991		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
992		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

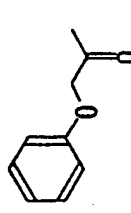
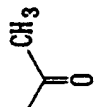
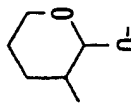
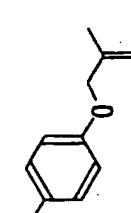
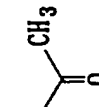
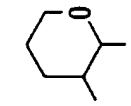
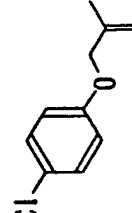
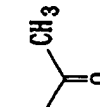
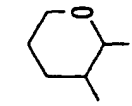
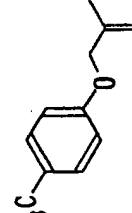
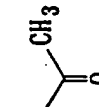
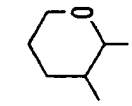
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
993		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
994		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
995		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
996		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

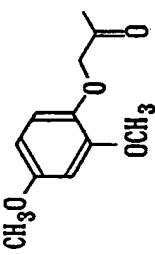
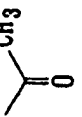
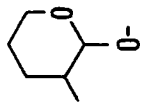
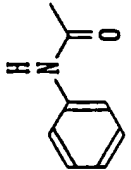
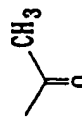
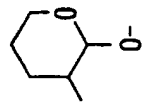
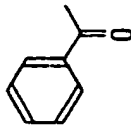
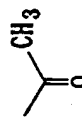
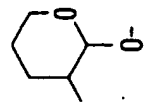
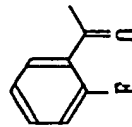
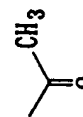
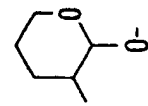
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
997		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
998		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
999		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1000		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

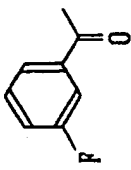
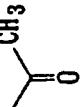
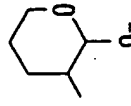
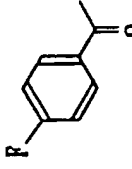
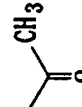
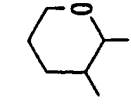
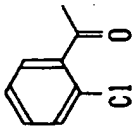
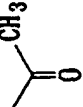
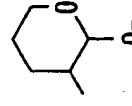
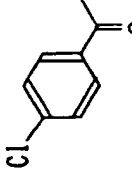
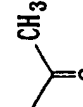
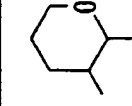
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1001		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1002		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1003		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1004		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

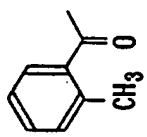
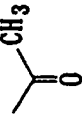
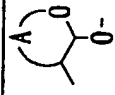
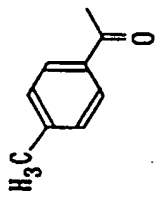
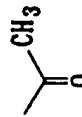
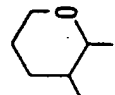
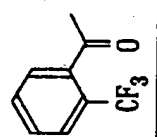
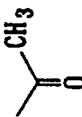
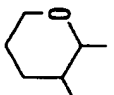
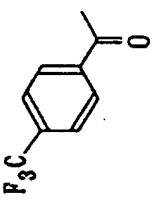
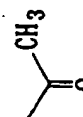
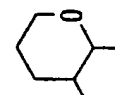
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1005		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1006		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1007		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1008		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

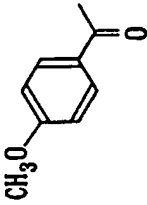
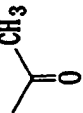
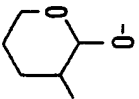
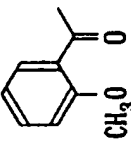
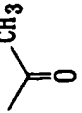
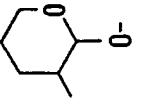
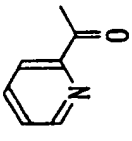
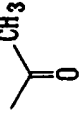
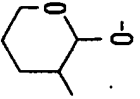
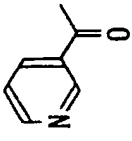
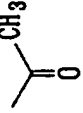
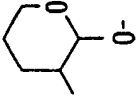
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1009		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1010		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1011		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1012		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

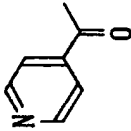
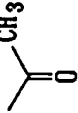
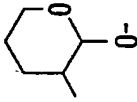
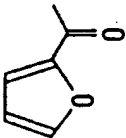
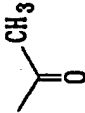
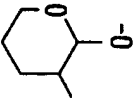
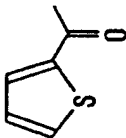
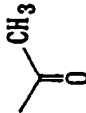
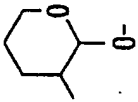
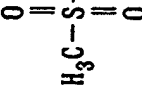
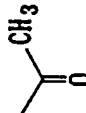
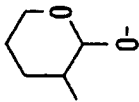
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1013		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1014		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1015		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1016		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

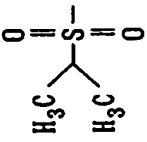
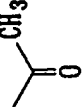
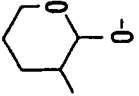
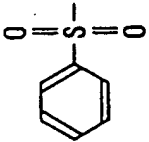
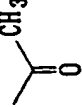
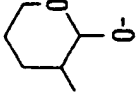
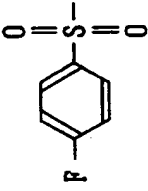
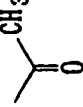
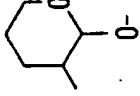
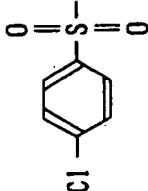
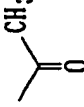
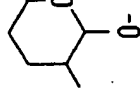
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1017		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1018		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1019		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1020		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

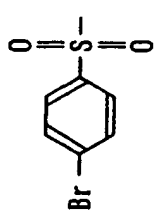
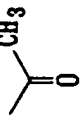
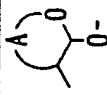
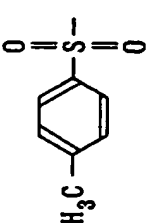
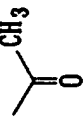
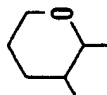
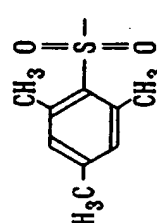
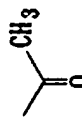
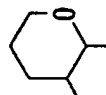
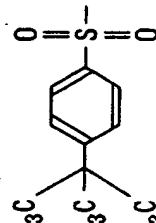
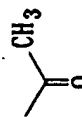
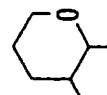
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1021		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1022		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1023		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1024		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

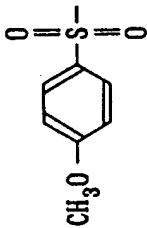
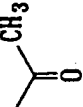
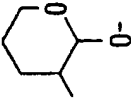
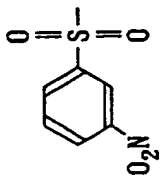
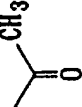
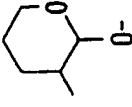
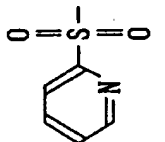
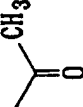
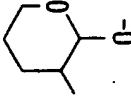
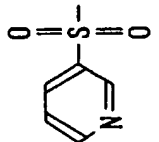
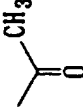
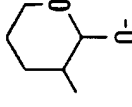
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1025		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1026		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1027		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1028		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

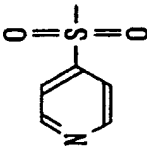
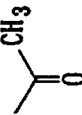
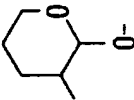
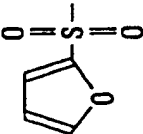
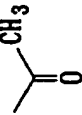
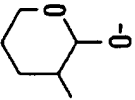
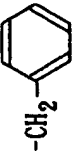
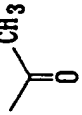
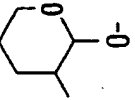
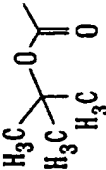
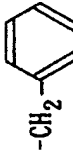
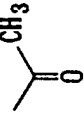
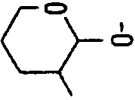
化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
1029		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1030		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1031	H-	-H		-H		
1032		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
1033		-H		-H		
1034		-H		-H		
1035		-H		-H		
1036		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	A
1037		-H		-H		
1038		-H		-H		
1039		-H		-H		
1040		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	(A)
1041		-H		-H		
1042		-H		-H		
1043		-H		-H		
1044		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1045		-H		-H		
1046		-H		-H		
1047		-H		-H		
1048		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	
1049		-H		-H		
1050		-H		-H		
1051		-H		-H		
1052		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

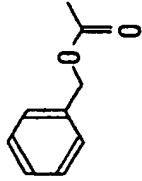
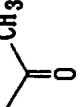
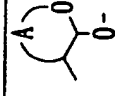
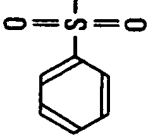
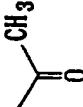
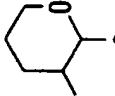
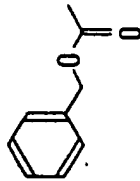
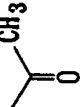
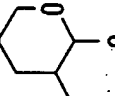
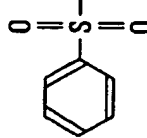
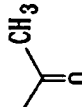
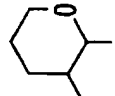
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1053		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1054		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1055		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		
1056		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H		

表 - 2 (つづき)

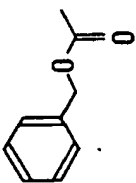
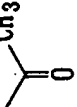
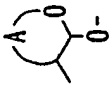
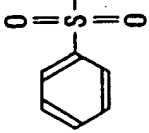
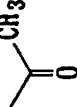
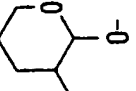
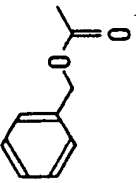

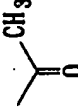
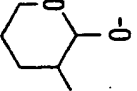
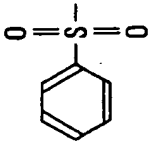

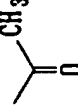
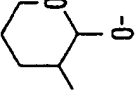
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1057		-H	-CH ₂ OH	-H		
1058		-H	-CH ₂ OH	-H		
1059		-H		-H		
1060		-H		-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1061		H-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃ CO-		
1062		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1063		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1064		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1065		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1066		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1067		CH ₃ CO-		H-		
1068		CH ₃ CO-		H-		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1069		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1070		CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H-		
1389		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1390		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

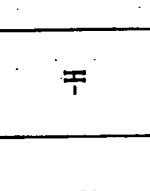
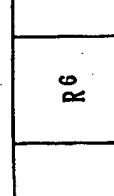

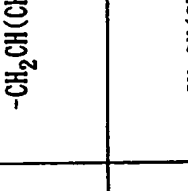
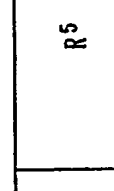

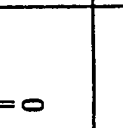


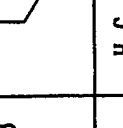
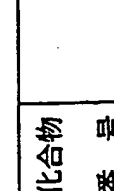

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1391		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1392		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1393		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1394		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 2 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1395		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1396		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1397		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1398		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 3 (n = 1 の場合)

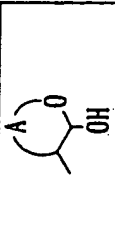
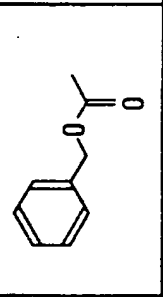
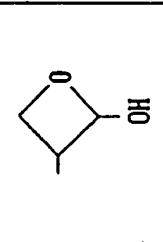
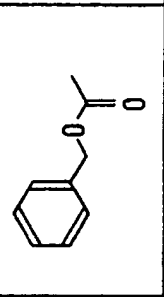
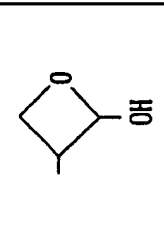
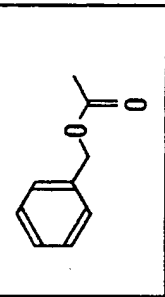
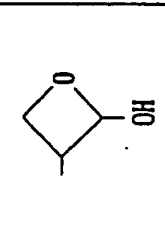
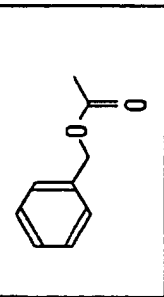
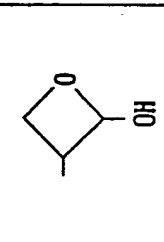
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1071		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	
1072		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H	
1073		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1074		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

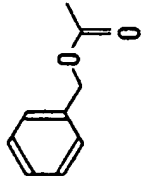
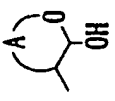
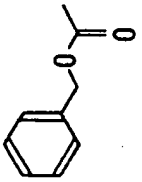
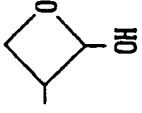
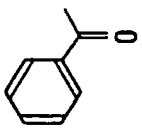
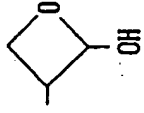
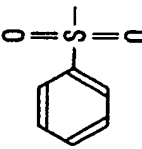
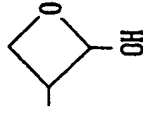
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1075		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1076		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1077		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1078		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1079		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1080		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
1081		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	
1082		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

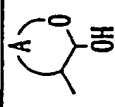
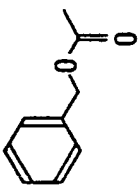
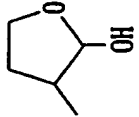
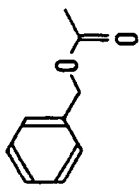
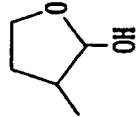
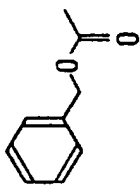
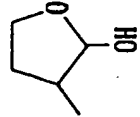
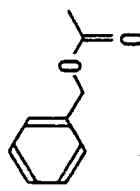
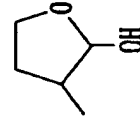
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1083		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	
1084		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H	
1085		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₃	-H	
1086		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

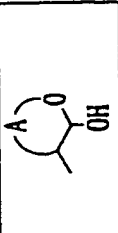
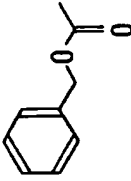
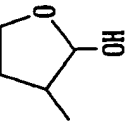
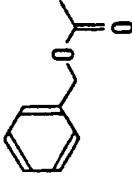
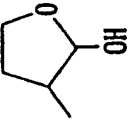
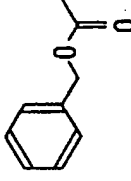
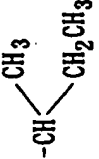
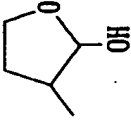
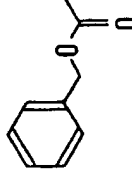
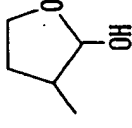
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1087		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
1088		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1089		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1090		-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

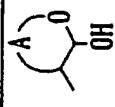
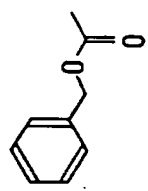
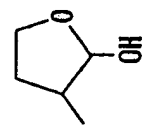
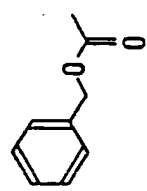
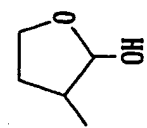
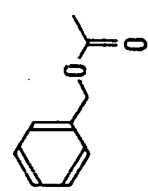
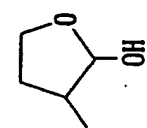
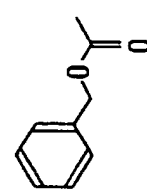
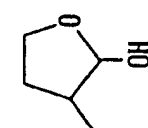
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1091		-H	-CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1092		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1093		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1094		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

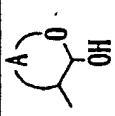
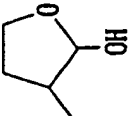
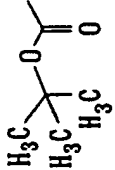
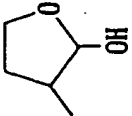
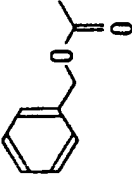
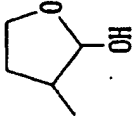
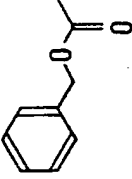
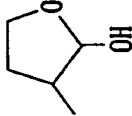
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1095	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1096		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1097		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1098		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

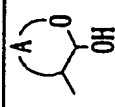
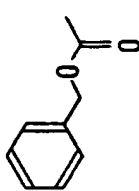
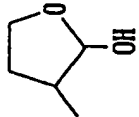
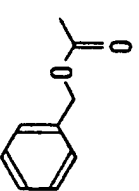
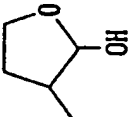
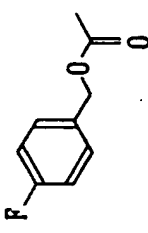
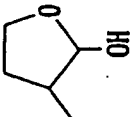
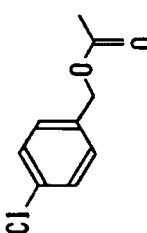
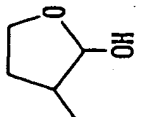
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1099		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1100		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	
1101		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1102		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

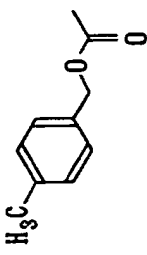
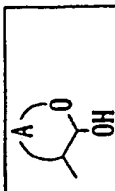
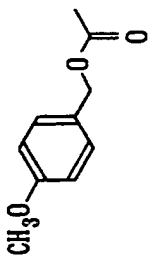
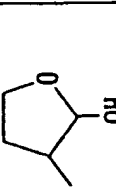
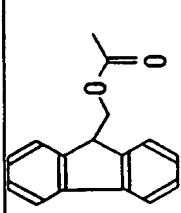
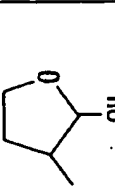
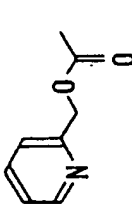
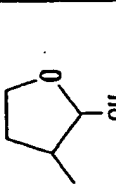
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	(A)
1103		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1104		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1105		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1106		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

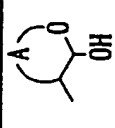
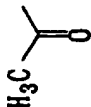
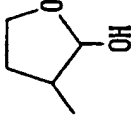
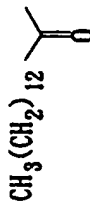
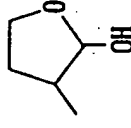
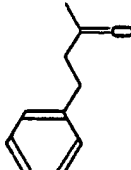
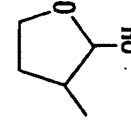
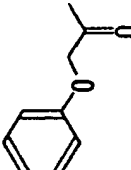
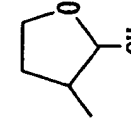
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1107		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1108		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1109		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1110		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

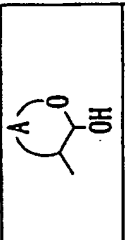
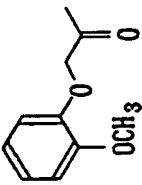
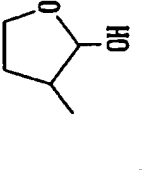
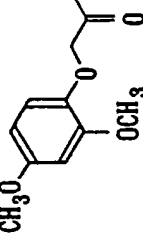
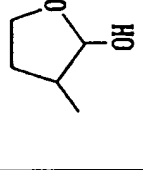
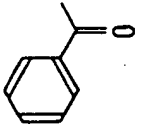
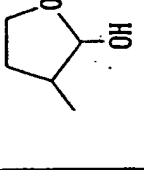
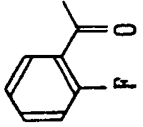
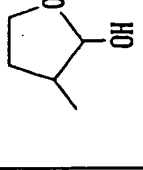
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1111		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1112		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1113		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1114		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1115		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1116		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1117		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1118		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1119		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1120		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1121		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1122		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

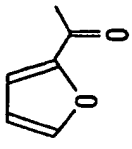
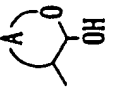
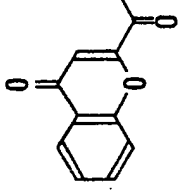
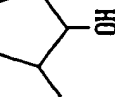
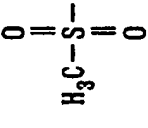
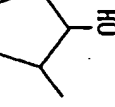
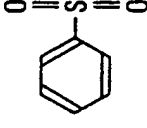
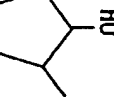
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1123		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1124		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1125		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1126		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1127		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1128		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1129		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1130		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1131		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1132		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1133		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1134		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

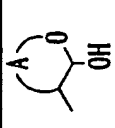
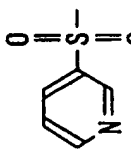
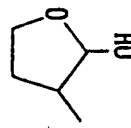
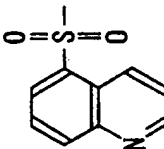
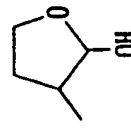
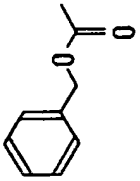

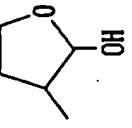
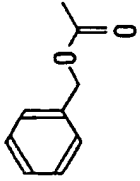
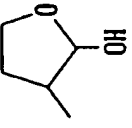
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1135		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1136		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1137		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1138		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1139		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1140		-H	-CH ₂ OH	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1141		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1142		-H	-H	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

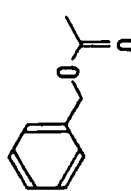
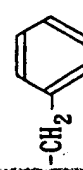
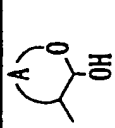
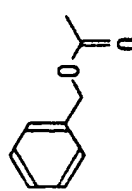
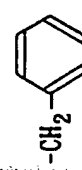
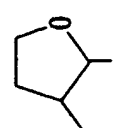
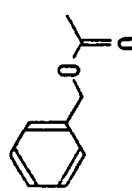
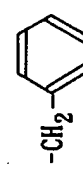
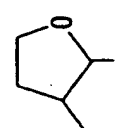
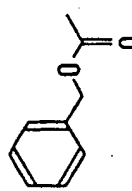
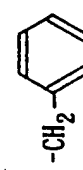
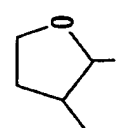
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1143		-H	-CH ₃	-H		-H	
1144		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H	
1145		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1146		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

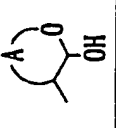
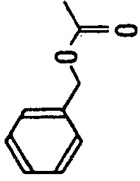
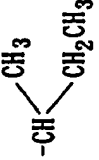
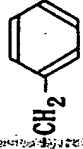

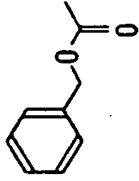
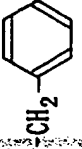
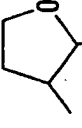
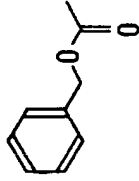
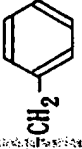

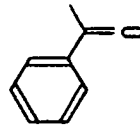
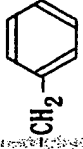

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1147		-H		-H		-H	
1148		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		-H	
1149		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		-H	
1150		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

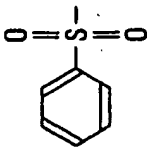
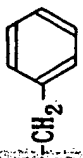
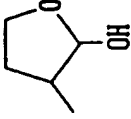
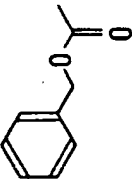
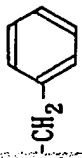
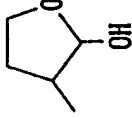
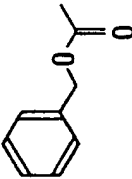
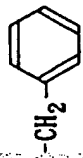
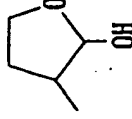
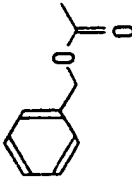

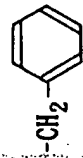
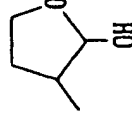
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	(A)
1151		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1152		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		-H	
1153		-H	-CH ₂ OH	-H		-H	
1154		-H		-H		-H	

表 - 3 (つづき)

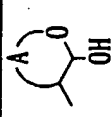
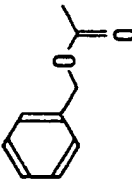
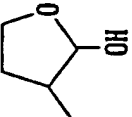
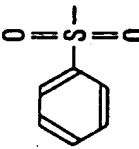
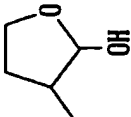
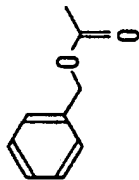
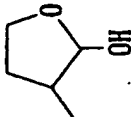
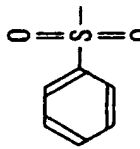
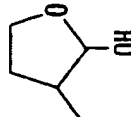
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1155		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
1156		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
1157		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	
1158		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	(A)
1159		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1160		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1161		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	
1162		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1163		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1164		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
1165		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1166		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

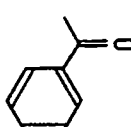
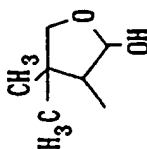
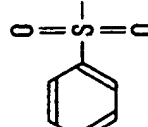
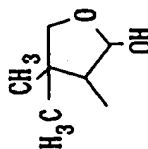
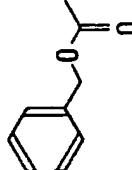
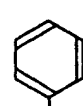
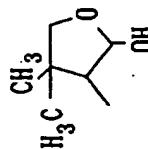
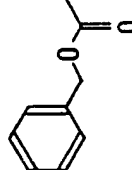
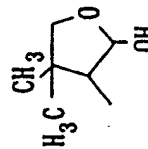
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	(A)
1167		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1168		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1169		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1170		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

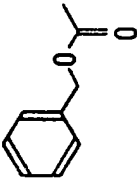
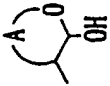
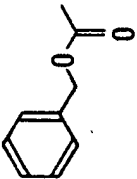

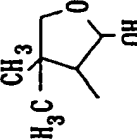
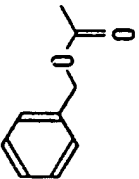
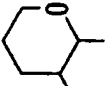
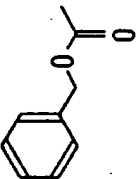
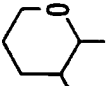
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1171		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	
1172		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1173		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	
1174		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

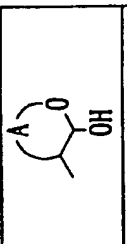
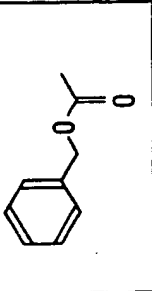
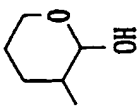
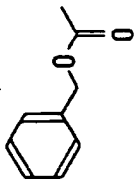
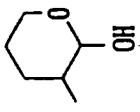
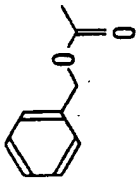
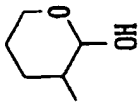
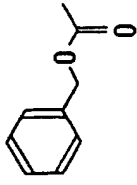
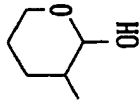
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1175		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₃	-H	
1176		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	
1177		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	
1178		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

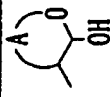
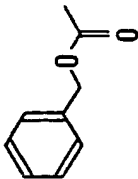
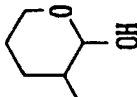
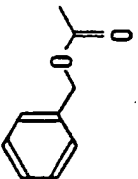
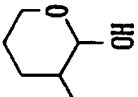
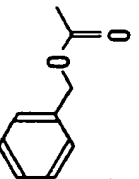
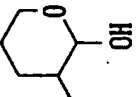
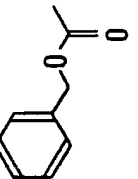
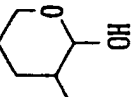
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1179		-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1180		-H	-CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1181		-H	-CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1182		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

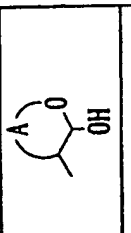
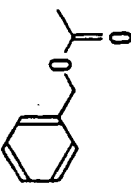
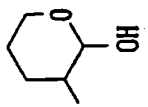
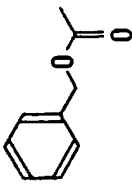
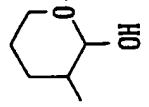
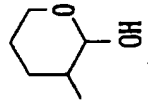
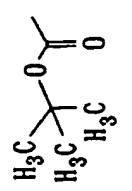
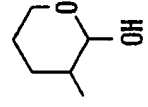
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1183		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1184		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1185	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1186		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

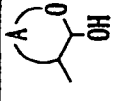
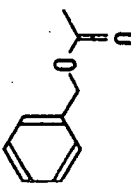
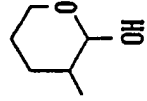
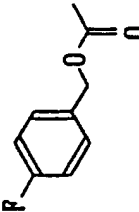
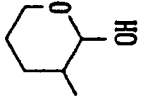
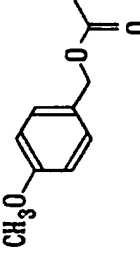
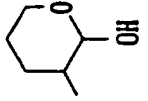
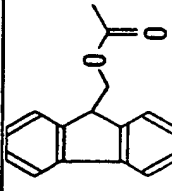
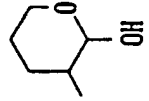
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1187		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1188		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1189		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1190		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

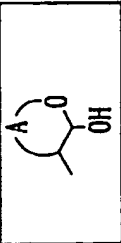
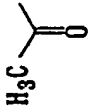
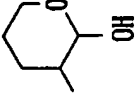
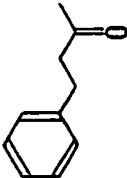
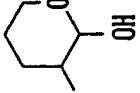
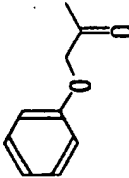
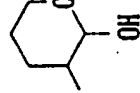
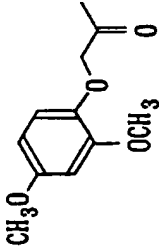
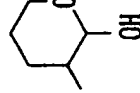
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1191		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1192		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1193		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1194		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

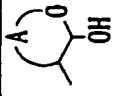
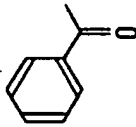
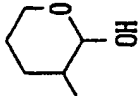
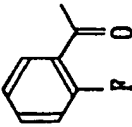
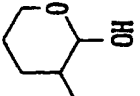
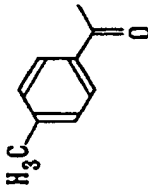
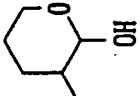
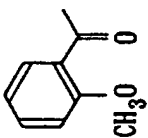
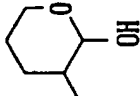
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1195		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1196		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1197		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1198		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

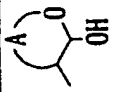
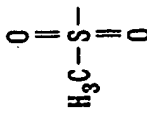
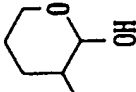
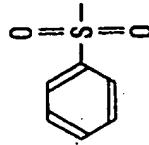
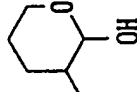
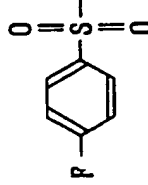
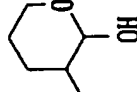
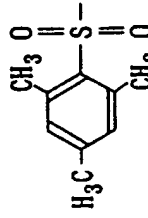
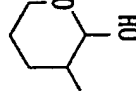
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1199		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1200		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1201		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1202		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

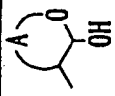
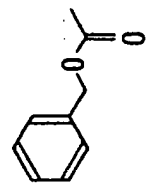
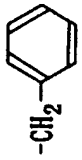
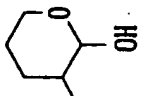
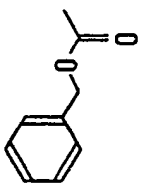
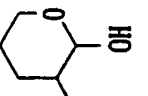
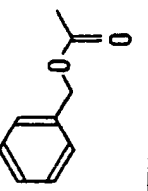
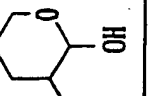
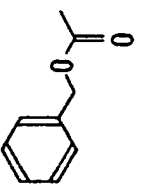
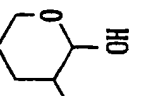
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1203		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1204		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1205		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1206		-H	-CH ₂ OH	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	

表 - 3 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1207		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	
1208		-H	-H	-H		-H	
1209		-H	-CH ₃	-H		-H	
1210		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

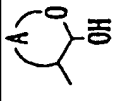
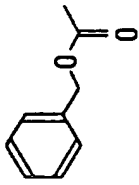
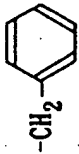
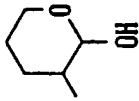
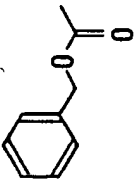
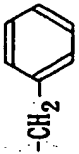
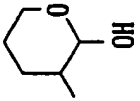
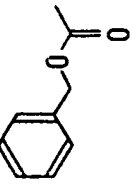
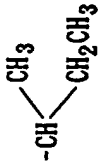

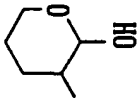
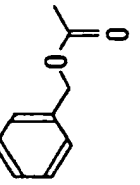
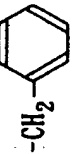
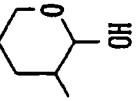
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1211		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1212		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H	
1213		-H		-H		-H	
1214		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

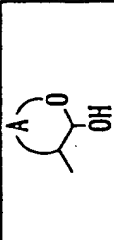
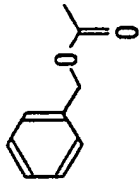
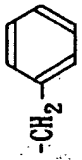
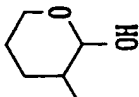
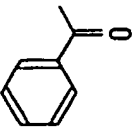
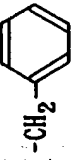
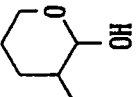
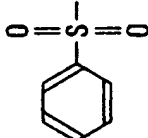
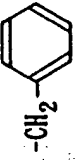
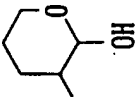
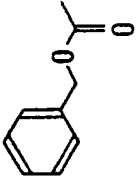
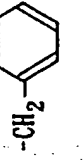
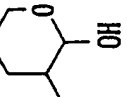
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1215		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1216		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1217		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1218		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		-H	

表 - 3 (つづき)

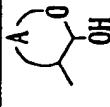
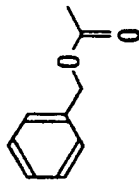
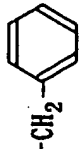
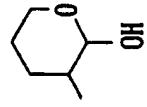
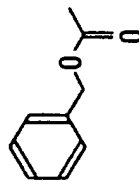

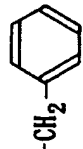
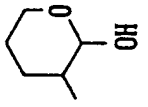
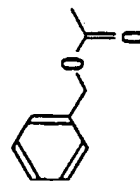
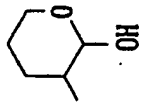
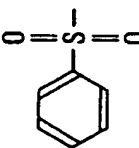
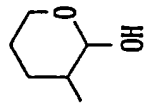
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1219		-H	-CH ₂ OH	-H		-H	
1220		-H		-H		-H	
1221		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	
1222		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	

表 - 3 (つづき)

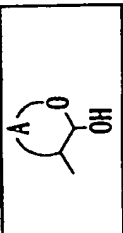
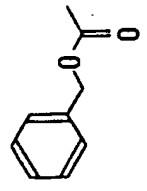
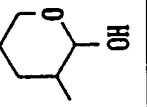
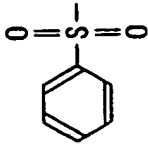
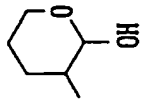
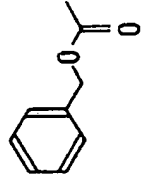
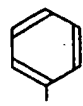
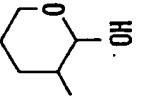
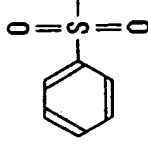
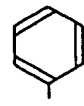
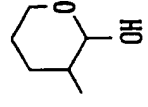
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	
1223		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	
1224		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H	
1225		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	
1226		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H	

表 - 4 (n = 1 の場合)

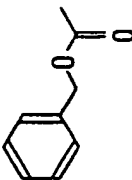
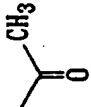
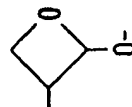
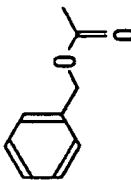
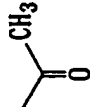
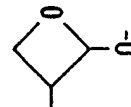
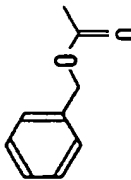
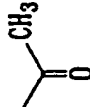
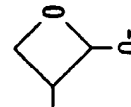
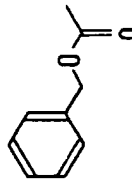
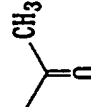
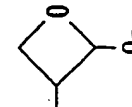
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1227		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H		
1228		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H		
1229		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1230		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1231		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1232		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1233		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1234		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1235		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1236		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1237		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H		
1238		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1239		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H	-H		
1240		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H	-CH3	-H		
1241		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H	-CH2CH3	-H		
1242		-H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	-H	-CH2CH2CH3	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1243		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
1244		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1245		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1246		-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

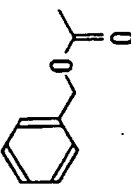
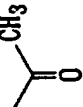
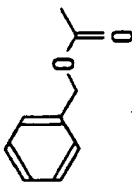
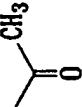
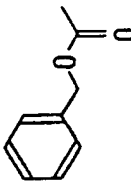
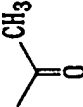
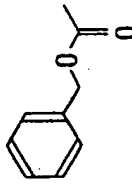
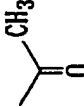
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1247		-H	-CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1248		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1249		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1250		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

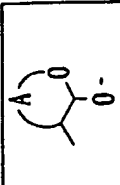

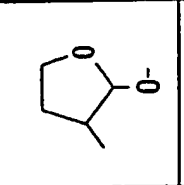
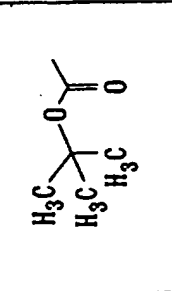
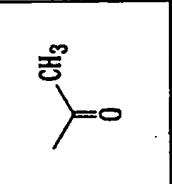
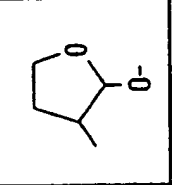
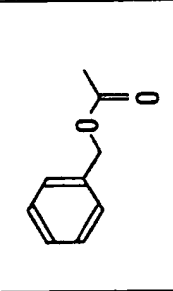
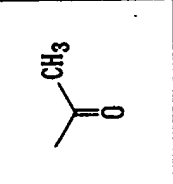
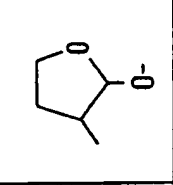
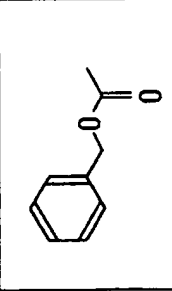
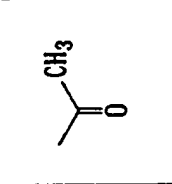
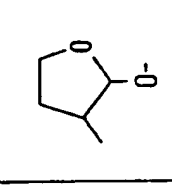
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1251	H-	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1252		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1253		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1254		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1255		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1256		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃		
1257		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1258		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

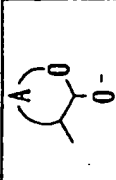
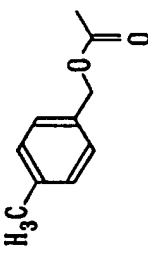
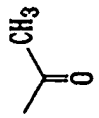
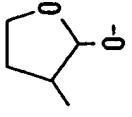
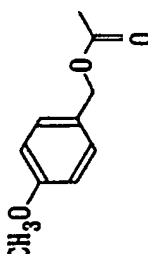
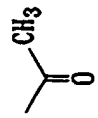
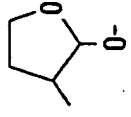
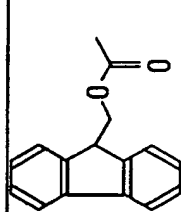
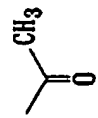
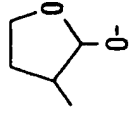
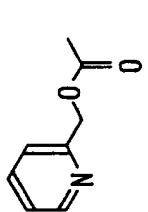
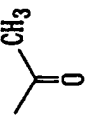
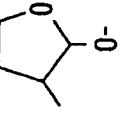
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1259		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1260		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1261		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1262		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

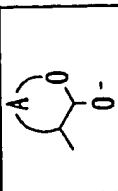
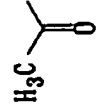
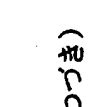

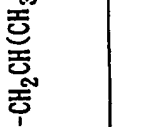


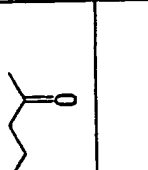


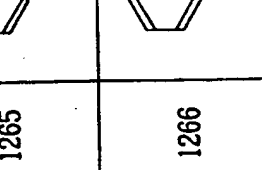


化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1263		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1264		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1265		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1266		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1267		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1268		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1269		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1270		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

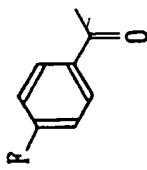
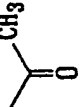
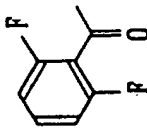
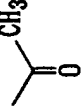
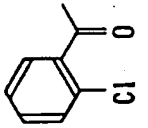
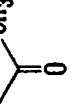
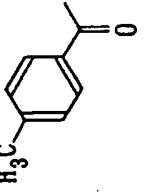
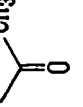
化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1271		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1272		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1273		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1274		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1275		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1276		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1277		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1278		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

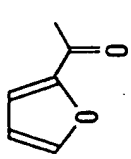
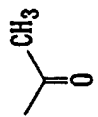
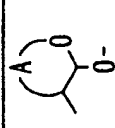
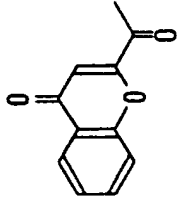
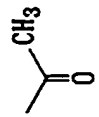
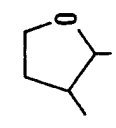
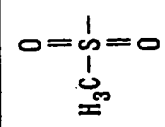
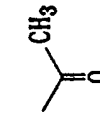
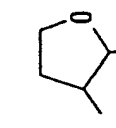
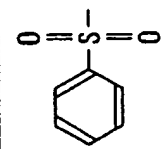
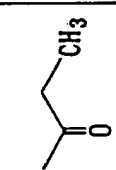
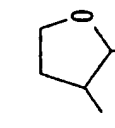
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1279		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1280		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1281		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1282		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

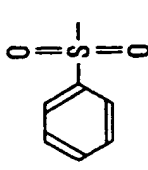

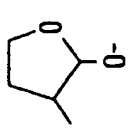
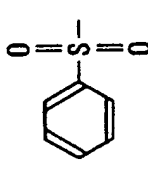
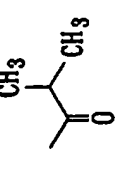
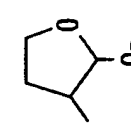
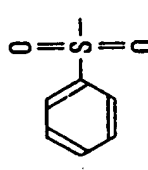
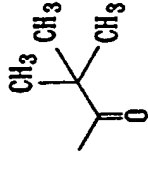
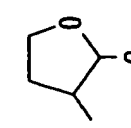
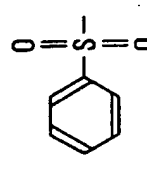
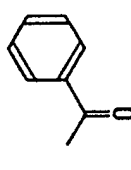
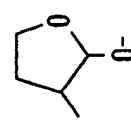
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1283		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1284		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1285		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1286		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

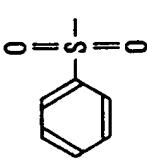
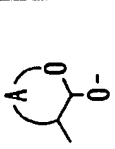
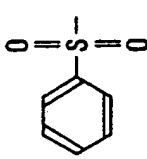
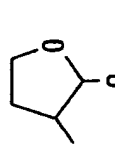
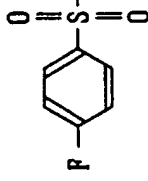
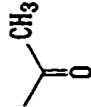
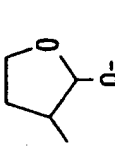
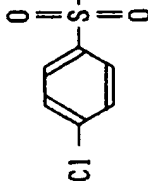
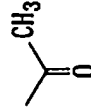
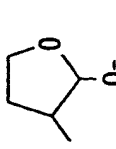
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1287		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	
1288		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-C(CH ₃) ₃	
1289		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1290		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1291		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1292		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1293		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1294		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

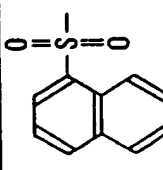
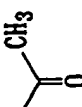
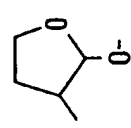
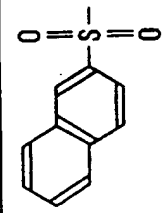
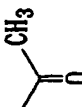
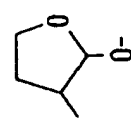
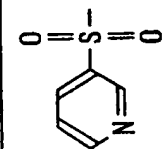
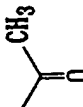
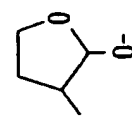
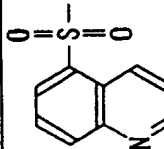
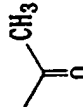
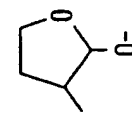
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1295		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1296		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1297		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1298		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)


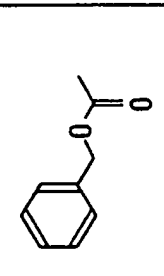
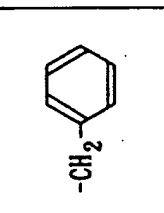
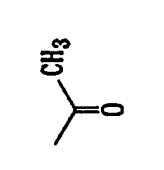
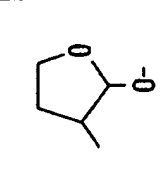
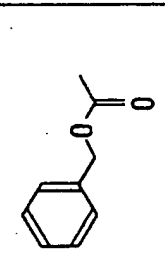
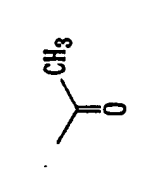
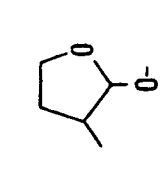
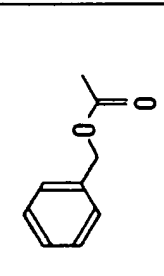
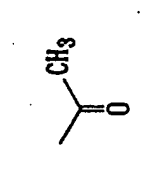
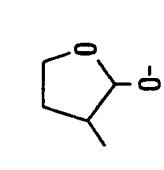
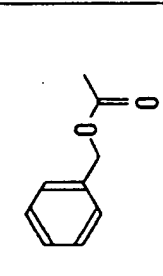
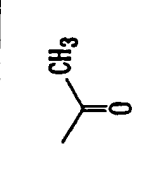
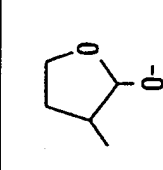
化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1299		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1300		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1301		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1302		-H	-CH ₂ OH	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	(A)
1303		-H		-H	-CH2CH(CH3)2	-H		
1304		-H	-H	-H		-H		
1305		-H	-CH3	-H		-H		
1306		-H	-CH2CH2CH3	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1307		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1308		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H		
1309		-H		-H		-H		
1310		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1311		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1312		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1313		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1314		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

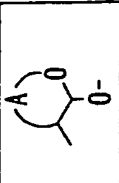
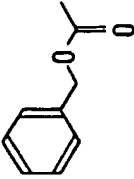

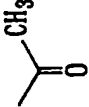
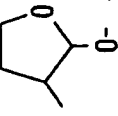
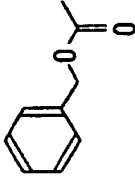


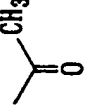
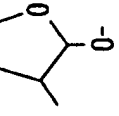
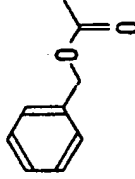
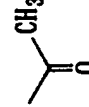
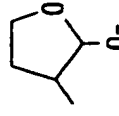
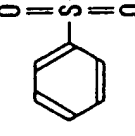
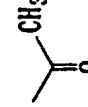
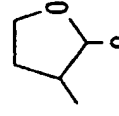
化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1315		-H	-CH ₂ OH	-H	-CH ₂ - 	-H		
1316		-H		-H	-CH ₂ - 	-H		
1317		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1318		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	
1319		-H	-CH2CH(CH3)2	-H	-CH2OH	-H		
1320		-H	-CH2CH(CH3)2	-H	-CH2OH	-H		
1321		-H	-CH2CH(CH3)2	-H		-H		
1322		-H	-CH2CH(CH3)2	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

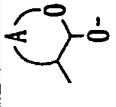
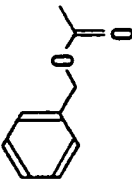
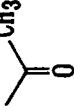
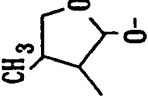
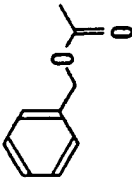
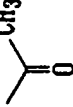
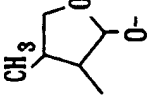
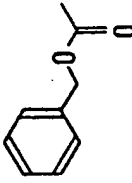
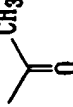
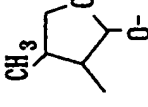
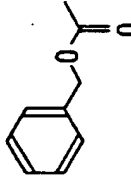
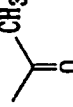
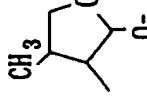
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1323		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H		
1324		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H		
1325		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1326		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1327		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1328		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1329		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1330		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1331		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1332		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1333		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H		
1334		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1335		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H		
1336		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	-H		
1337		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₃	-H		
1338		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		

表 - 4 (つづき)

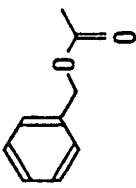
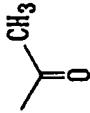
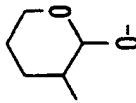
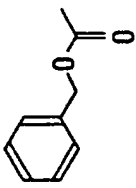
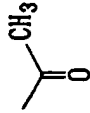
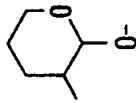
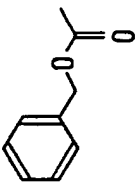
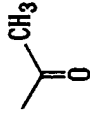
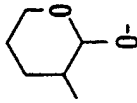
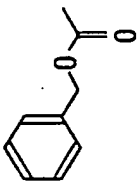
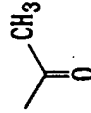
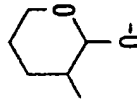
化合物 番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	(A)
1339		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		
1340		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		
1341		-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1342		-H	-CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1343		-H	-CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1344		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1345		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1346		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

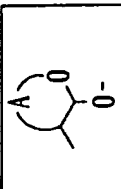
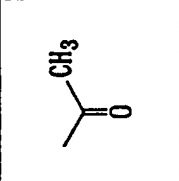
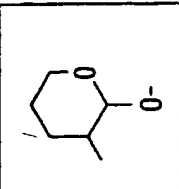
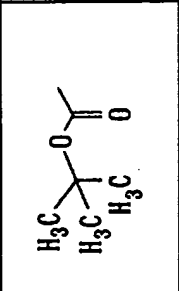
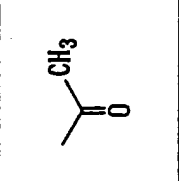
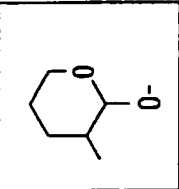
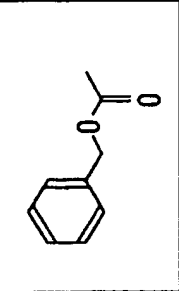
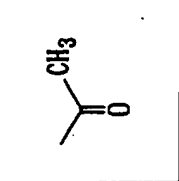
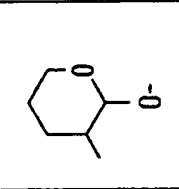
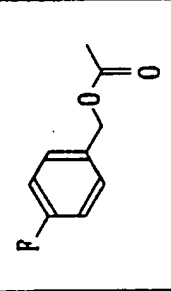
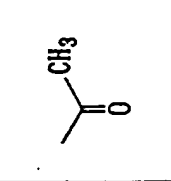
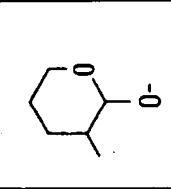
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1347	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1348		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1349		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1350		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

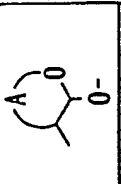
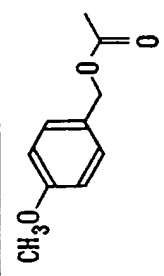
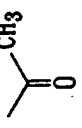
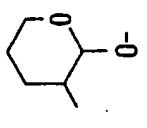
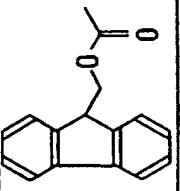
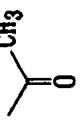
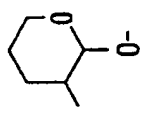
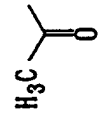
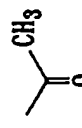
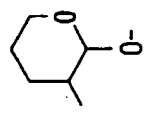
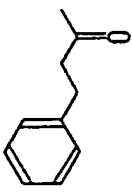
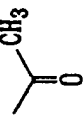
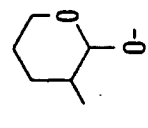
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1351		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1352		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1353		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1354		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

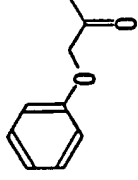
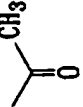

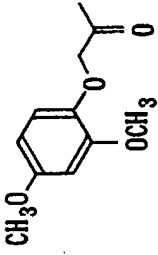
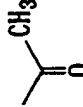
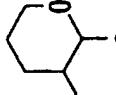
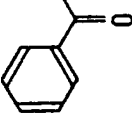
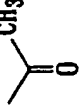
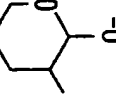
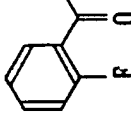
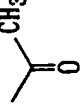
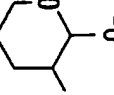
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1355		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1356		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1357		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1358		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

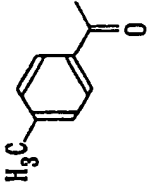
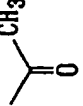
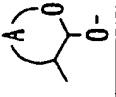
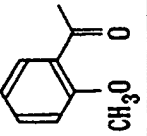
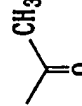
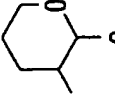
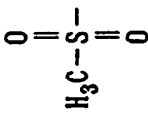
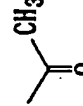
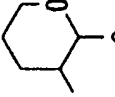
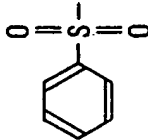
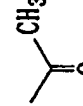
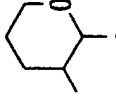
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(A)
1359		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1360		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1361		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1362		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

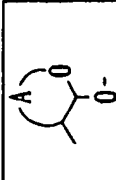
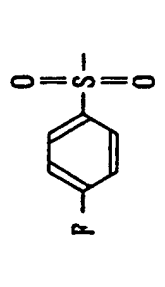
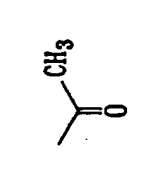
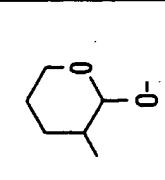
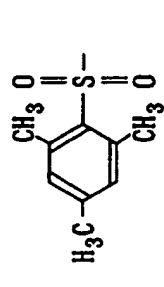
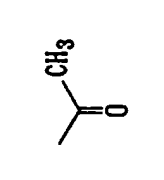
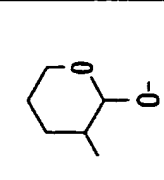
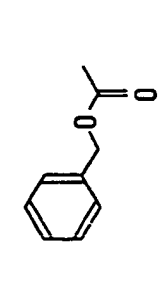
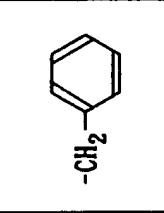
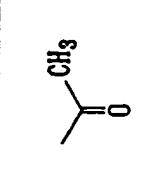
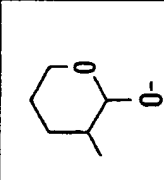
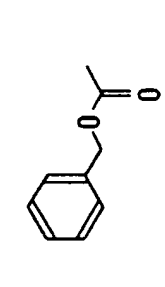
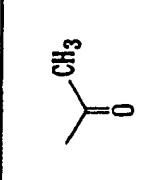
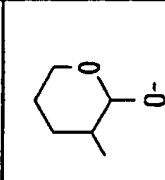
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1363		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1364		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1365		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1366		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		

表 - 4 (つづき)

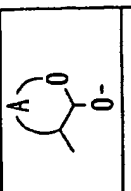
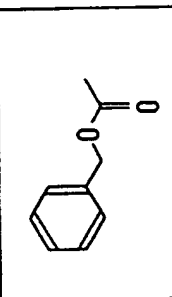
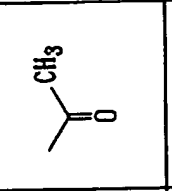
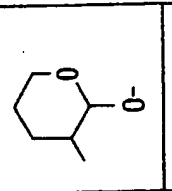
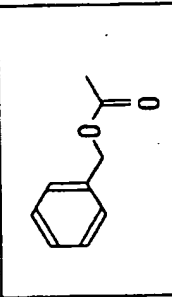
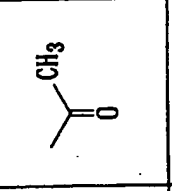
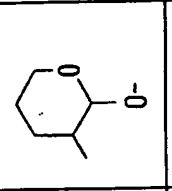
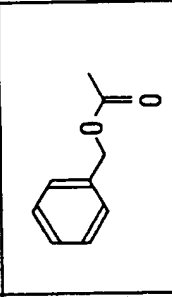
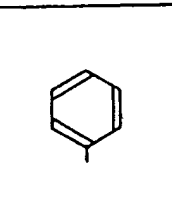
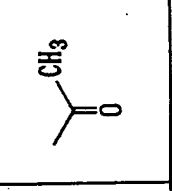
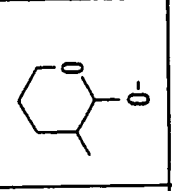
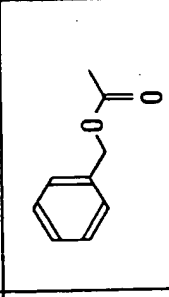
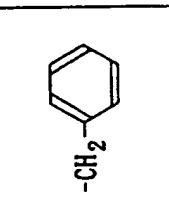
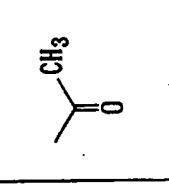
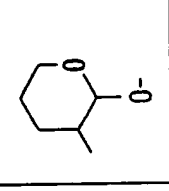
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1367		-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1368		-H	-CH ₂ OH	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1369		-H		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		
1370		-H	-H	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1371		-H	-CH ₃	-H		-H		
1372		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H		
1373		-H	-CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1374		-H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A
1375		-H		-H		-H		
1376		-H		-H		-H		
1377		-H		-H		-H		
1378		-H		-H		-H		

表 - 4 (つづき)

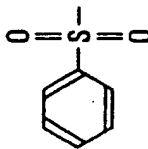
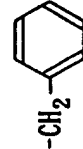
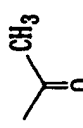
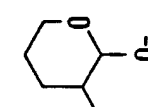
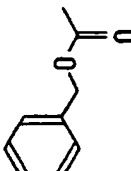
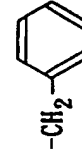
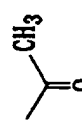
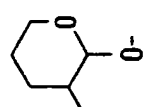
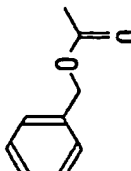
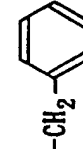
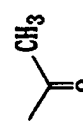
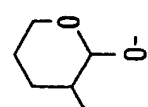
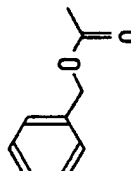
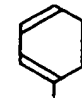
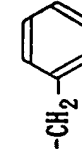
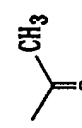
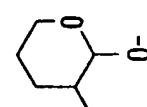
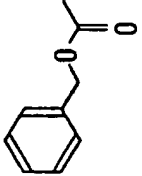

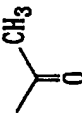
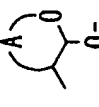
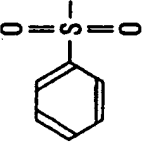

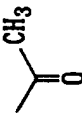
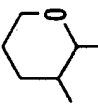
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1379		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1380		-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		-H		
1381		-H	-CH ₂ OH	-H		-H		
1382		-H		-H		-H		

表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1383		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1384		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H		
1385		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H		
1386		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₂ OH	-H		

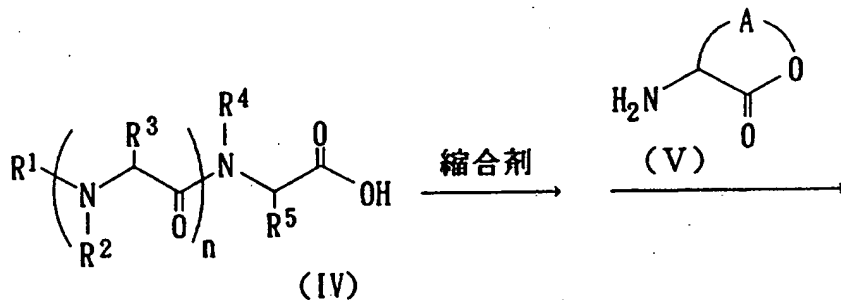
表 - 4 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	
1387		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		
1388		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H		-H		

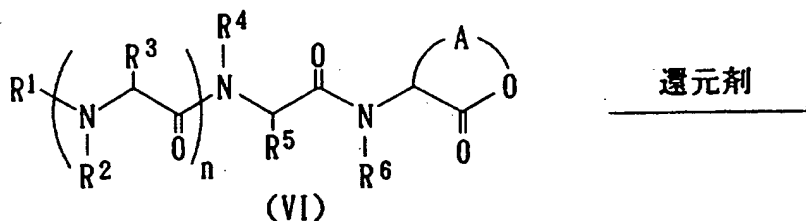
次に本発明の化合物の製造法について説明する。上記一般式 (I) で表される含酸素複素環誘導体は、例えば次のような方法で製造することができる。

製造法 1 : R⁷ が水素原子である化合物の製造法

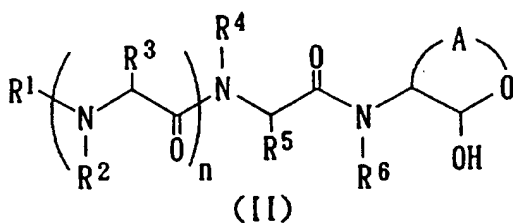
5



10



15

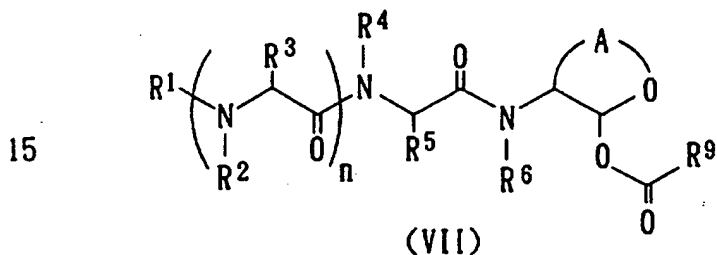
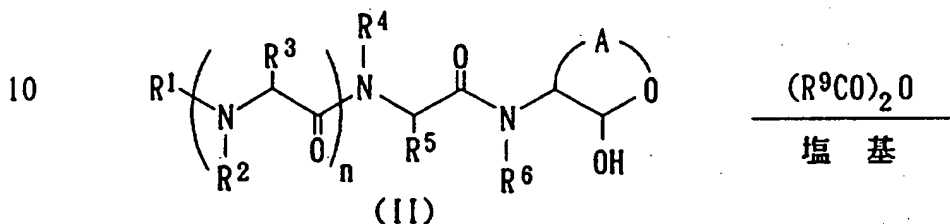


(上記一般式において、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Aおよび
20 nは既に定義した通りである)

上記一般式 (IV) で表されるアミノ酸誘導体を、必要に応じてトリエチルアミン、ピリジン等の塩基の存在下、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジフェニルホスホリルアジド、カルボニルジイミダゾール、オキサリルクロリド、クロル蟻酸イソブチル、塩化チオニル等の縮合剤と反応させてカルボン酸を活性化させ、次に上記一般式 (V) で表されるラクトン誘導体を反応させると、上記一般式 (VI) で表される化合物が得られる。この縮
25

合反応に用いる溶媒は、各縮合剤に適した溶媒を適宜選んで使用すればよく、また反応条件等も各縮合剤に適した条件で行えばよい。次に得られた化合物 (VI) を水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム/塩化セリウム等の還元剤で処理すると上記一般式 (II) で表される含酸素複素環誘導体を得ることができる。

製造法 2 : R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ である化合物の製造法

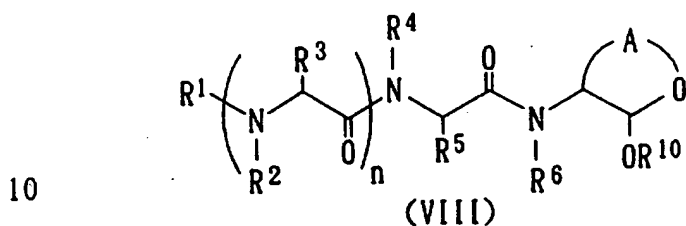
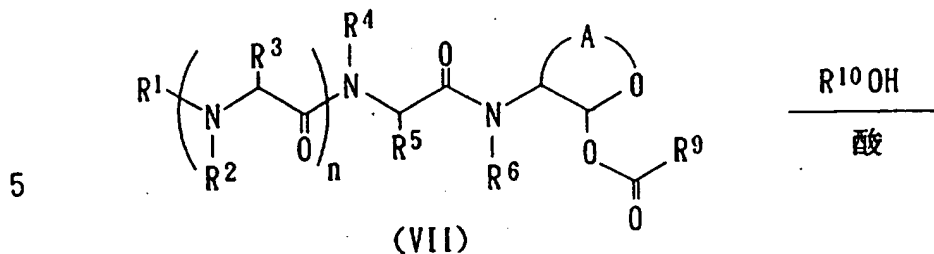


(上記一般式において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 A および n は既に定義した通りである)

20 製造法 1 により製造した含酸素複素環誘導体を、塩化メチレン、1, 2-ジクロロエタン、ジメチルホルムアミド、 N -メチルピロリドン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、トルエン等の有機溶媒に溶解し、ピリジン、トリエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン等の塩基の存在下、上記一般式 $(R^9 \text{CO})_2 \text{O}$ で表される酸無水物を反応させると、上記式 (VII) で表される含酸素複素環誘導体を得ることができる。

25 この反応は、無溶媒で行うこともできる。

製造法 3 : R¹ が C₁ ~ C₅ のアルキル基である化合物の製造法



(上記一般式において、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁹、A および n は既に定義した通りであり、R¹⁰ は C₁ ~ C₅ のアルキル基を表す)

15 製造法 2 で得られた化合物 (VII) を、R¹⁰OH で表されるアルコールに溶解し、塩酸、硫酸等の酸を触媒量加えて攪拌すると、上記一般式 (VIII) で表される化合物が得られる。

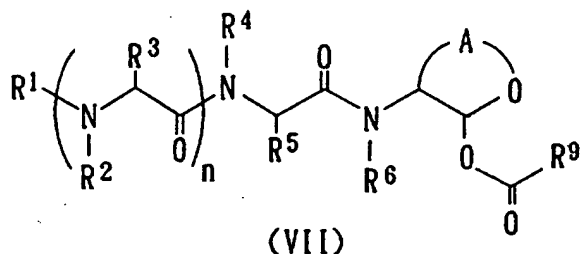
20 上記の一連の操作において、官能基の保護、脱保護が必要になる場合もあるが、その際の保護基はその官能基に適したものを選択し、実験操作も文献公知の方法を用いて行えばよい。

かくして得られた本発明の含酸素複素環誘導体のうち、R¹ が水素原子の化合物 (II) は、システインプロテアーゼに対して強い阻害活性を示す。

25 また、R¹ が C₁ ~ C₅ のアルキル基の化合物 (VIII) および R⁹ - C(=O)- (R⁹ は C₁ ~ C₁₀ のアルキル基または置換基を有していてもよい C₆ ~ C₁₂ のアリール基を表す) の化合物 (VII) は、システインプロテアーゼに

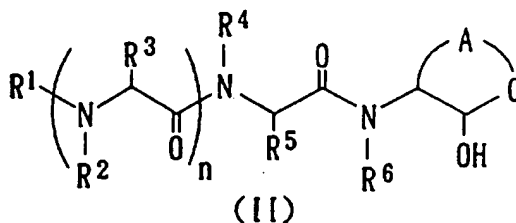
対して強い阻害活性を示す含酸素複素環誘導体 (II) のプロドラッグとして用いることができる。すなわち、化合物 (VII) または (VIII) を経口投与すると、腸管等から吸収された後、生体内の酵素などの働きによりすみやかに活性本体である含酸素複素環誘導体 (II) が遊離されてくる。

5

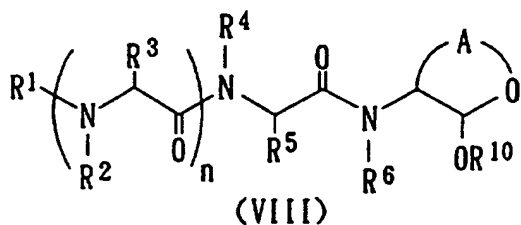


10

生体内
→



15



20

かかる本発明化合物を臨床に応用するに際し、治療上有効な成分の担体成分に対する割合は、1重量%から90重量%の間で変動されうる。例えば、本発明の化合物は顆粒剤、細粒剤、散剤、硬カプセル剤、軟カプセル剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤または液剤等の剤形にして経口投与してもよいし、注射剤として静脈内投与、筋肉内投与または皮下投与してもよい。また、座剤として用いることもできる。また、注射用の粉末にして用事調製して使用してもよい。経口、経腸、非経口に適した医薬用の有機または無機の、固体または液体の担体もしくは希釈剤を本発明薬剤を調製するために用いることができる。固体製剤を製造する際に用いられる賦形剤としては、例えば乳糖、蔗糖、デンプン、タルク、セルロース、デキストリン、カオリン、炭酸カルシウム等が用いられる。経口投与のための液体製剤、

25

すなわち乳剤、シロップ剤、懸濁剤、液剤等は、一般的に用いられる不活性な希釈剤、例えば水または植物油等を含む。この製剤は、不活性な希釈剤以外に補助剤、例えば湿潤剤、懸濁補助剤、甘味剤、芳香剤、着色剤または保存剤等を含むことができる。液体製剤にしてゼラチンのような吸収されうる物質のカプセル中に含ませてもよい。非経口投与の製剤、すなわち注射剤、座剤等の製造に用いられる溶剤または懸濁剤としては、例えば水、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ベンジルアルコール、オレイン酸エチル、レシチン等が挙げられる。座剤に用いられる基剤としては、例えばカカオ脂、乳化カカオ脂、ラウリン脂、ウィテップゾール等が挙げられる。製剤の調製方法は常法によればよい。

臨床投与量は、経口投与により用いられる場合には、成人に対し本発明の化合物として、一般には一日量0.01~1000mgであるが、年齢、病態、症状により適宜増減することがさらに好ましい。前記一日量の本発明薬剤は、一日に一回、または適当な間隔をおいて一日に2もしくは3回に分けて投与してもよいし、間欠投与してもよい。

また、注射剤として用いる場合には、成人に対し本発明の化合物として、一日量0.001~100mgを連続投与又は間欠投与することが望ましい。

図面の簡単な説明

第1図は、実施例88の化合物をラットの血清に5分間インキュベートした後のHPLCチャートであり、第2図は、血清がない場合の、実施例1の化合物と実施例88の化合物を混合して溶解したサンプルのHPLCチャートである。

発明を実施するための最良の形態

以下、参考例および実施例により本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はその要旨を越えない限り、これらの参考例および実施例に何ら制限

を受けるものではない。

参考例1 (S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニル
アミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランの製造

塩化チオニル6mlを-5℃に冷却し、この反応液にN-フェニルスル
5 ホニル-L-ロイシン998mgを加え-5℃で10分間攪拌した後、室
温に戻しさらに3時間攪拌した。つぎに反応液を減圧下濃縮し、得られた
残渣にトルエン10mlを加え濃縮し残渣として粗なN-フェニルスルホ
ニル-L-ロイシル=クロリドを得た。得られた粗なN-フェニルスルホ
ニル-L-ロイシル=クロリドを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷下
10 L-ホモセリンラクトン塩酸塩443mgおよびトリエチルアミン0.9
46mlを加えた。反応液を氷冷下15分間攪拌した後さらに室温で1.
5時間攪拌した。反応終了後反応液に希塩酸を加え、塩化メチレンで抽出
した。抽出液を水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグ
ネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得られた残渣に
15 酢酸エチル10mlおよびヘキサン20mlを加え攪拌し生成した結晶を
濾取し目的物861mgを得た。

収率：76%

融点：183-184℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3331, 3256, 1772, 1649.

20 NMR (CDCl_3 , δ) : 0.67 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 3H),
0.84 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 3H), 1.45-1.56 (m, 3H),
, 2.01 (m, 1H), 2.63 (m, 1H), 4.26 (m, 1H),
, 4.36 (m, 1H), 4.45 (ddd, $J=9.3\text{Hz}$, 9.3
Hz, 1.8Hz, 1H), 5.28 (d, $J=8.1\text{Hz}$, 1H), 6
25 .67 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.60
(m, 1H), 7.88 (dd, $J=7.2\text{Hz}$, 1.5Hz, 2H).

実施例1 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニ
ルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラン-1-オール(表-1の化合
物番号196)の製造

参考例1で得られた(S)-3-((S)-2-フェニルスルホニルア
ミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラン-1-オール413m
5 gを塩化メチレン60mlに溶解し、-78°Cに冷却した。つぎに反応液
に1.01mol/lの水素化ジイソブチルアルミニウムのトルエン溶液
3.81mlを加えた。3時間後反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液お
よび酢酸エチルを加え、室温に戻した後セライトで濾過し、セライトを酢
10 酸エチルでよく洗浄した。濾液を飽和食塩水で洗浄後硫酸マグネシウムで
乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得られた残渣をシリカゲル
カラムクロマトグラフィー(展開溶媒30%ヘキサン含有酢酸エチル)で
精製し、目的物191mgを得た。

収率: 46%

15 融点: 162°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3337, 3260, 1649

NMR (CDCl_3 , +DMSO- d_6 , δ): 0.72 (d, $J=6.6$ Hz, 2.7H), 0.78 (d, $J=6.3$ Hz, 0.3H), 0.
84 (d, $J=6.6$ Hz, 2.7H), 0.86 (d, $J=6.3$ Hz
20 , 0.3H), 1.46 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 1.63 (m,
2H), 2.09 (m, 0.9H), 2.25 (m, 0.1H), 3.6
8-3.81 (m, 2H), 3.99-4.12 (m, 2H), 4.95
(br s, 0.1H), 5.03 (d, $J=3.6$ Hz, 0.1H),
5.15 (dd, $J=3.9$ Hz, 3.9 Hz, 0.9H), 5.63 (
25 d, $J=3.9$ Hz, 0.9H), 6.68 (d, $J=9.3$ Hz, 0.1
H), 6.81 (d, $J=8.1$ Hz, 0.9H), 6.89 (d, $J=$

7. 8 Hz, 0. 9 H), 7. 1 4 (d, J=7. 2 Hz, 0. 1 H),
7. 4 6-7. 5 8 (m, 3 H), 7. 8 5 (m, 2 H). この溶媒での
異性体比は約 9 : 1 である。

NMR (CD₃ OD, δ) : 0. 7 4 (d, J=6. 5 Hz, 3 H),
5 0. 8 0 (d, J=6. 5 Hz, 3 H), 0. 8 6 (d, J=7. 1 Hz
, 3 H), 0. 8 8 (d, J=6. 8 Hz, 3 H), 1. 3 4-1. 5 0
(m, 3 H), 1. 6 4 (m, 1 H), 2. 0 1 (m, 0. 4 H), 2.
1 7 (m, 0. 6 H), 3. 7 3-3. 9 7 (m, 4 H), 4. 9 6 (s
, 0. 6 H), 5. 1 1 (d, J=4 Hz, 0. 4 H), 7. 5 3-7.
10 6 1 (m, 3 H), 7. 8 5 (m, 2 H). この溶媒での異性体比は約 6
: 4 である。

参考例 1 および実施例 1 と同様の方法により、以下実施例 2 から実施例
8 7 の化合物を製造した。以下、その物性値を記す。

実施例 2 (3 S) - 3 - ベンジロキシカルボニルアミノアセチルアミノ
15 - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1 の化合物番号 1 7) の製造

融点 : 1 1 9 - 1 2 1 °C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3 3 1 4, 1 6 9 2, 1 6 4 9, 1 5 4 1.

NMR (CDCl₃, δ) : 1. 8 4 (m, 1 H), 2. 2 2-2. 5
0 (m, 1 H), 2. 8 6 (s, 0. 3 H), 2. 9 7 (s, 0. 7 H)
20 , 3. 7 9-4. 0 0 (m, 3 H), 4. 1 1 (m, 1 H), 4. 3 7 (m,
1 H), 5. 1 4 (s, 2 H), 5. 2 7 (m, 1. 3 H), 5. 3
9 (s, 0. 7 H), 6. 1 2 (s, 0. 3 H), 6. 4 2 (s, 0. 7
H), 7. 3 6 (m, 5 H).

実施例 3 (3 S) - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ
25 プロピオニルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1 の化合物番
号 1 8) の製造

融点：161-163°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3312, 1688, 1647, 1561,
1530.

NMR (CDCl_3 , δ) : 1.36 (d, $J=7.2\text{Hz}$, 0.75
5 H), 1.39 (d, 7.2Hz , 2.25H), 1.81 (m, 1H)
, 2.34 (m, 0.75H), 2.43 (m, 0.25H), 2.99
(s, 0.25H), 3.09 (s, 0.75H), 3.87 (ddd,
 $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz , 7.8Hz , 0.75H), 4.00 (m
, 0.25H), 4.11 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.3
10 7 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.29 (m, 2H), 6.2
8 (s, 0.25H), 6.45 (s, 0.75H), 7.35 (m, 5
H).

実施例4 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ
パレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号2
15 0)の製造

融点：148-149°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3299, 1694, 1645, 1539.
NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 (m, 3H), 1.38 (m, 2
H), 1.62 (m, 1H), 1.78 (m, 2H), 2.31 (m, 0
20 .7H), 2.42 (m, 0.3H), 3.27 (s, 0.3H), 3.
42 (s, 0.7H), 3.86 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz
, 7.8Hz , 0.7H), 3.98 (m, 0.3H), 4.11 (m,
2H), 4.33 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.27 (m,
1.3H), 5.38 (d, $J=7.1\text{Hz}$, 0.7H), 6.30 (s
25 , 0.3H), 6.46 (d, $J=8.0\text{Hz}$, 0.7H), 7.35 (m,
5H).

実施例5 3-(S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルブチリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号21)の製造

融点: 122-123°C

5 IR (KBr, cm^{-1}): 3302, 1694, 1647, 1537.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (m, 6H), 1.83 (m, 1H), 2.12 (m, 1H), 2.30 (m, 0.6H), 2.44 (m, 0.4H), 3.40 (s, 0.4H), 3.49 (s, 0.6H), 3.82-4.06 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 4.38 (m, 1H), 5.09 (m, 2H), 5.26 (s, 0.4H), 5.32 (s, 0.6H), 5.50 (m, 1H), 6.32 (s, 0.2H), 6.45 (s, 0.4H), 6.54 (s, 0.2H), 6.68 (s, 0.2H), 7.34 (m, 5H).

15 実施例6 (3S)-3-(S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノヘキサノイルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号22)の製造

融点: 165-166°C

20 IR (KBr, cm^{-1}): 3304, 1694, 1645, 1539.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (m, 3H), 1.32 (m, 3H), 1.64 (m, 2H), 1.78 (m, 2H), 2.29 (m, 0.8H), 2.42 (m, 0.2H), 3.22 (s, 0.2H), 3.39 (s, 0.8H), 3.86 (ddd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz , 7.8 Hz , 0.8H), 3.99 (m, 0.2H), 4.11 (m, 2H), 4.33 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.17-5.44 (m, 2H), 6.27 (s, 0.2H), 6.47 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 0.8H), 7.34 (m, 5H).

実施例7 (3S)-3-((2S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号23)の製造

融点: 169-171°C

- 5 IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1694, 1649, 1539.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.91 (m, 6H), 1.12 (m, 1H), 1.50 (m, 1H), 1.84 (m, 2H), 2.31 (m, 0.7H), 2.44 (m, 0.3H), 3.40 (s, 1H), 3.82-4.16 (m, 3H), 4.35 (m, 1H), 5.10 (s, 2H),
10 , 5.26 (m, 1H), 5.41 (s, 1H), 6.17 (s, 0.3H), 6.40 (s, 0.7H), 7.38 (m, 5H).

実施例8 (3S)-3-((S)-2-アミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール塩酸塩(表-1の化合物番号24)の製造

- 15 NMR (CD_3OD , δ): 1.00 (d, $J=5.6\text{ Hz}$, 6H), 1.69-1.83 (m, 3H), 1.98 (m, 1H), 2.24 (m, 0.5H), 2.34 (m, 0.5H), 3.84-4.07 (m, 4H), 4.95 (s, 0.5H), 4.99 (d, $J=4.0\text{ Hz}$, 0.5H).

- 20 実施例9 3-((S)-2-メトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号25)の製造

融点: 139-141°C

- 25 IR (KBr, cm^{-1}): 3287, 3081, 1686, 1653, 1553.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (m, 6H), 1.50-1.7

4 (m, 3H), 1.81 (m, 1H), 2.36 (m, 0.6H), 2.48 (m, 0.4H), 3.44 (s, 0.4H), 3.58 (s, 0.6H), 3.68 (s, 3H), 3.99 (m, 0.6H), 4.01 (m, 0.4H), 4.13 (m, 2H), 4.34 (m, 1H), 5.27 (d, $J=3.0$ Hz, 0.6H), 5.34 (m, 1.4H), 6.49 (s, 0.4H), 6.57 (d, $J=7.8$ Hz, 0.4H), 6.68 (s, 0.2H).

実施例10 (3S)-3-((S)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号27)の製造

融点: 65-70°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1698, 1657.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.95 (m, 6H), 1.44 (s, 4.5H), 1.44 (s, 4.5H), 1.48 (m, 1H), 1.66 (m, 2H), 1.81 (m, 1H), 2.33 (m, 0.5H), 2.46 (m, 0.5H), 3.88 (ddd, $J=7.5$ Hz, 7.5 Hz, 7.5 Hz, 0.5H), 4.01 (ddd, $J=8.4$ Hz, 8.4 Hz, 8.4 Hz, 0.5H), 4.12 (m, 2H), 4.36 (m, 1H), 4.96 (d, $J=7.8$ Hz, 0.5H), 5.03 (m, 0.5H), 5.26 (s, 0.5H), 5.33 (s, 0.5H), 6.47 (m, 0.5H), 6.61 (m, 0.5H).

実施例11 (3S)-3-((S)-2-イソブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号28)の製造

融点: 31-33°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1699, 1657, 1543.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.94 (m, 12H), 1.47-2.00 (m, 5H), 2.36 (m, 0.5H), 2.45 (m, 0.5H), 2.96 (s, 0.5H), 3.17 (s, 0.5H), 3.90 (m, 1.5H), 4.02 (m, 0.5H), 4.15 (m, 2H), 4.36 (m, 1H), 5.08 (m, 1H), 5.27 (s, 0.5H), 5.35 (s, 0.5H), 6.24 (s, 0.5H), 6.50 (s, 0.5H).

実施例12 (3S)-3-((S)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号29)の製造

融点: 52-54°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3310, 1703, 1659, 1545.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.93 (m, 8H), 1.26-1.33 (m, 4H), 1.43-1.92 (m, 9H), 2.36 (m, 0.5H), 2.50 (m, 0.5H), 3.22 (s, 0.5H), 3.49 (s, 0.5H), 3.87-4.23 (m, 5H), 4.34 (m, 1H), 5.13 (m, 1H), 5.26 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 5.32 (dd, J=3.9Hz, 3.9Hz, 0.5H), 5.34 (s, 0.5H), 6.53 (s, 0.5H).

実施例13 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号31)の製造

融点: 40-43°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3306, 1705, 1657.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.92 (d, J=6.1Hz, 3H), 0.94 (d, J=5.9Hz, 3H), 1.52 (m, 1H), 1.6

4 (m, 2H), 1.78 (m, 1H), 2.29 (m, 0.5H), 2.41 (m, 0.5H), 3.51 (s, 0.5H), 3.74 (s, 0.5H), 3.85 (ddd, J=8.0Hz, 8.0Hz, 8.0Hz, 0.5H), 3.97 (m, 0.5H), 4.10 (m, 2H), 4.32 (m, 1H), 5.09 (s, 1H), 5.10 (s, 1H), 5.24 (s, 0.5H), 5.29 (s, 0.5H), 5.35 (d, J=6.5Hz, 0.5H), 5.38 (d, J=8.2Hz, 0.5H), 6.45 (d, J=6.0Hz, 0.5H), 6.57 (d, J=6.0Hz, 0.5H), 7.33 (m, 5H).

10 実施例14 (3S)-3-[(S)-2-(N-ベンジロキシカルボニル-N-メチル)アミノ-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号32)の製造

IR (neat) : 3335, 1669.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0.93 (m, 6H), 1.49 (m, 1H), 1.69 (m, 3H), 2.28 (m, 0.5H), 2.39 (m, 0.5H), 2.85 (s, 1.5H), 2.86 (s, 1.5H), 3.12 (s, 0.5H), 3.30 (s, 0.5H), 3.85 (m, 1H), 4.07 (m, 1H), 4.29 (m, 1H), 4.60 (m, 0.5H), 4.70 (m, 0.5H), 5.09-5.26 (m, 3H), 20) , 6.24 (s, 0.5H), 6.53 (s, 0.5H), 7.36 (m, 5H).

実施例15 (3S)-3-[(S)-2-(4-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号37)の製造

25 融点 : 50-52°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3310, 1705, 1657, 1607.

1 5 4 1, 1 5 1 4.

NMR (CDCl₃, δ) : 0. 9 3 (m, 6H), 1. 4 7-1. 9
0 (m, 4H), 2. 3 2 (m, 0. 5H), 2. 4 4 (m, 0. 5H)
5 , 3. 1 0 (s, 0. 5H), 3. 3 5 (s, 0. 5H), 3. 8 7 (d
d d, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 5H), 3. 9 8
(m, 0. 5H), 4. 1 1 (m, 2H), 4. 3 3 (m, 1H), 5.
0 4 (s, 1H), 5. 0 6 (s, 1H), 5. 2 5 (m, 2H), 6.
2 0 (b s, 0. 5H), 6. 4 6 (d, J=8. 1 Hz, 0. 5H),
7. 0 3 (d d, J=8. 7 Hz, 2H), 7. 3 3 (m, 2H).

10 実施例 1 6 (3S)-3-{(S)-2-(2-クロロベンジロキシカ
ルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラ
ノール (表-1の化合物番号38)の製造

融点: 46-49°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3308, 1707, 1657, 1541.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0. 9 4 (m, 6H), 1. 4 8-1. 8
6 (m, 4H), 2. 3 2 (m, 0. 6H), 2. 4 8 (m, 0. 4H)
, 2. 9 0 (s, 0. 4H), 3. 0 9 (s, 0. 6H), 3. 8 8 (d
d d, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 6H), 4. 0 1
(m, 0. 4H), 4. 1 1 (m, 2H), 4. 3 4 (m, 1H), 5.
20 2 3 (s, 2H), 5. 2 5 (m, 2H), 6. 1 8 (s, 0. 4H),
6. 4 5 (d, J=7. 6 Hz, 0. 6H), 7. 2 6 (m, 2H), 7
. 4 0 (m, 2H).

25 実施例 1 7 (3S)-3-{(S)-2-(4-クロロベンジロキシカ
ルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラ
ノール (表-1の化合物番号40)の製造

融点: 47-49°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3308, 1705, 1657, 1541.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.94 (m, 6H), 1.50-1.86 (m, 4H), 2.32 (m, 0.7H), 2.44 (m, 0.3H), 2.88 (s, 0.3H), 3.03 (s, 0.7H), 3.88 (dd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 0.7H), 3.95 (m, 0.3H), 4.12 (m, 2H), 4.35 (m, 1H), 5.06 (s, 0.6H), 5.07 (s, 1.4H), 5.22 (m, 1.3H), 5.30 (s, 0.7H), 6.09 (s, 0.3H), 6.39 (d, $J=8.7\text{ Hz}$, 0.7H), 7.31 (m, 4H).

10 実施例 18 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (2 - メチルベンジロキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフランール (表 - 1 の化合物番号 44) の製造

融点 : 120 ~ 122 °C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3302, 1694, 1645, 1541.

15 NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (m, 6H), 1.52 (m, 1H), 1.59 (m, 3H), 2.16-2.49 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 3.28 (s, 0.5H), 3.52 (s, 0.5H), 3.86 (dd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 0.5H), 3.98 (m, 0.5H), 4.13 (m, 2H), 4.31 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.27 (m, 2H), 6.34 (s, 0.5H), 6.51 (s, 0.5H), 7.19 (m, 2H), 7.31 (m, 2H).

25 実施例 19 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (4 - メチルベンジロキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフランール (表 - 1 の化合物番号 46) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1703, 1657, 1539.

NMR (CDC1₃, δ) : 0.93 (m, 6H), 1.52 (m, 1H), 1.58-1.86 (m, 3H), 2.29 (m, 0.5H), 2.35 (s, 3H), 2.43 (m, 0.5H), 2.91 (s, 0.5H), 3.03 (s, 0.5H), 3.87 (ddd, J=7.8 Hz, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 0.5H), 3.97 (m, 0.5H), 4.10 (m, 2H), 4.33 (m, 1H), 5.06 (s, 2H), 5.14 (m, 1H), 5.26 (m, 1H), 6.20 (s, 0.5H), 6.44 (s, 0.5H), 7.16 (m, 2H), 7.23 (m, 2H).

10 実施例 20 (3S)-3-[(S)-2-(2-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランオール (表-1の化合物番号47) の製造

融点 : 36-38°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3308, 1703, 1657, 1539.

15 NMR (CDC1₃, δ) : 0.93 (m, 6H), 1.51 (m, 1H), 1.60-1.91 (m, 3H), 2.30 (m, 0.6H), 2.42 (m, 0.4H), 3.15 (s, 0.4H), 3.31 (d, J=3.0 Hz, 0.6H), 3.83 (s, 3H), 3.87 (m, 0.6H), 3.91 (m, 0.4H), 4.13 (m, 2H), 4.32 (20 m, 1H), 5.16 (s, 0.8H), 5.18 (s, 1.2H), 5.23 (m, 2H), 6.65 (s, 0.4H), 6.53 (d, J=7.5 Hz, 0.6H), 6.91 (m, 2H), 7.31 (m, 2H).

25 実施例 21 (3S)-3-[(S)-2-(4-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランオール (表1の化合物番号49) の製造

融点 : 30-33°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1701, 1657, 1516.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 (m, 6H), 1.50 (m, 1H), 1.59-1.88 (m, 3H), 2.29 (m, 0.5H), 2.42 (m, 0.5H), 3.01 (s, 0.5H), 3.20 (d, $J=3.0\text{Hz}$, 0.5H), 3.80 (s, 3H), 3.88 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 3.96 (m, 0.5H), 4.11 (m, 2H), 4.33 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 5.15 (m, 1H), 5.27 (s, 0.5H), 5.32 (s, 0.5H), 6.22 (s, 0.5H), 6.66 (s, 0.5H), 6.87 (m, 2H), 7.28 (m, 2H).

実施例 22 (3S)-3-{(S)-2-(9-フルオレニルメトキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフランール (表-1の化合物番号51) の製造

融点 : 150-153°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3314, 1725, 1696, 1653, 1534.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (m, 6H), 1.65 (m, 3H), 1.91 (m, 1H), 2.32 (m, 0.7H), 2.42 (m, 0.3H), 3.08 (s, 0.3H), 3.28 (d, $J=3\text{Hz}$, 0.7H), 3.86 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.7H), 4.01 (m, 0.3H), 4.08-4.24 (m, 3H), 4.32-4.52 (m, 3H), 5.27 (m, 2H), 6.21 (s, 0.3H), 6.38 (s, 0.7H), 7.31 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.56 (dd, $J=7.4\text{Hz}$, 2H), 7.76 (d, $J=7.4\text{Hz}$, 2H).

実施例 23 (3S)-3-(S)-4-メチル-2-テトラヒドロフ

ルフリルオキシカルボニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフ
ラノール (表-1の化合物番号52) の製造

融点: 40 - 43°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3308, 1705, 1659, 1543.
5 NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (m, 6H), 1.46 - 2.0
7 (m, 8H), 2.32 (m, 0.5H), 2.46 (m, 0.5H)
, 3.36 (s, 0.5H), 3.39 (s, 0.5H), 3.78 - 4
. 25 (m, 8H), 4.29 - 4.42 (m, 1H), 5.28 (m,
1.5H), 5.40 (s, 0.5H), 6.34 (s, 0.5H), 5
10 . 56 (s, 0.5H).

実施例24 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (2 - テトラヒ
ドロピラニルメトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラ
ヒドロフラノール (表-1の化合物番号53) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3306, 1705, 1659, 1539.
15 NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (m, 6H), 1.30 (m, 1
H), 1.53 (m, 3H), 1.68 (m, 4H), 1.84 (m, 2
H), 2.32 (m, 0.5H), 2.47 (m, 0.5H), 3.44
(m, 1H), 3.55 (m, 1H), 3.65 (s, 0.5H), 3.
74 (s, 0.5H), 3.98 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz
20 , 7.8Hz , 0.5H), 4.00 (m, 3.5H), 4.12 (m,
2H), 4.35 (m, 1H), 5.28 (d, $J=3.0\text{Hz}$, 0.5
H), 5.31 (m, 1H), 5.46 (m, 0.5H), 6.45 (s
, 0.5H), 6.61 (m, 0.5H).

実施例25 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (2 - ピリジル
25 メトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフラノ
ール (表-1の化合物番号54) の製造

融点：54-56°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3306, 1711, 1657, 1541.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.95 (m, 6H), 1.53 (m, 2
H), 1.68 (m, 3H), 2.28 (m, 0.5H), 2.47 (m
5, 0.5H), 3.85 (ddd, $J=8.1\text{Hz}$, 8.1Hz , 8.1
Hz, 0.5H), 3.97 (ddd, $J=8.1\text{Hz}$, 8.1Hz , 8
. 1Hz , 0.5H), 4.08-4.44 (m, 3H), 5.10-5
. 36 (m, 3H), 5.75 (s, 1H), 6.67 (s, 0.5H)
, 6.69 (s, 0.5H), 7.19-7.40 (m, 2H), 7.6
10 9 (m, 1H), 8.50 (d, $J=3.9\text{Hz}$, 0.5H), 8.56
(d, $J=3.9\text{Hz}$, 0.5H).

実施例26 3-{(S)-4-メチル-2-(2-ピリジルメトキシカル
ボニルアミノ)バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール N-
オキシド (表-1の化合物番号57)の製造

15 NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (m, 6H), 1.50-1.9
2 (m, 4H), 2.10-2.48 (m, 1H), 2.86 (s, 0.
8H), 3.30 (s, 0.2H), 3.84 (m, 1H), 4.08 (
m, 1H), 4.36 (m, 2H), 5.10-5.68 (m, 3H),
5.99 (s, 0.5H), 6.12 (s, 0.3H), 6.30 (m,
20 0.2H), 6.82-7.07 (m, 1H), 7.35 (m, 3H),
8.28 (d, $J=8.6\text{Hz}$, 1H).

実施例27 (3S)-3-((S)-2-シクロヘキシルオキシカルボ
ニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール
(表-1の化合物番号60)の製造

25 融点：28-30°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1696, 1657, 1539.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.95 (m, 6H), 1.29 (m, 2H), 1.36 (m, 4H), 1.53 (m, 2H), 1.69 (m, 4H), 1.85 (m, 2H), 2.36 (m, 0.5H), 2.48 (m, 0.5H), 2.85 (s, 0.5H), 3.06 (s, 0.5H), 3.89 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 4.02 (m, 0.5H), 4.14 (m, 2H), 4.36 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.99 (m, 1H), 5.26 (m, 0.5H), 5.32 (m, 0.5H), 6.22 (s, 0.5H), 6.47 (s, 0.5H).

10 実施例28 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェノキシカルボニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号61)の製造

融点: 68-70°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3308, 1723, 1659, 1539.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0.98 (m, 6H), 1.52 (m, 1H), 1.58-1.86 (m, 3H), 2.30-2.52 (m, 1H), 2.98 (s, 0.6H), 3.23 (s, 0.4H), 3.89 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.6H), 4.01 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.4H), 4.09-4.27 (m, 2H), 4.38 (m, 1H), 5.27 (d, J=2.7Hz, 0.4H), 5.33 (dd, J=3.6Hz, 3.6Hz, 0.6H), 5.60 (s, 1H), 6.10 (s, 0.4H), 6.24 (s, 0.6H), 7.12 (m, 2H), 7.20 (m, 1H), 7.35 (m, 2H).

25 実施例29 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルウレイドバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号

63) の製造

融点: 181-182°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3291, 1638, 1555.

5 NMR (CDCl_3 , δ): 0.96 (m, 6H), 1.50 (m, 2
H), 1.67 (m, 1H), 1.86 (m, 1H), 2.26 (m, 0
. 5H), 2.41 (m, 0.5H), 2.88 (s, 0.5H), 3.
40 (s, 0.5H), 3.82 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz
, 7.8Hz , 0.5H), 4.07 (m, 1.5H), 4.29 (m,
2H), 5.20 (s, 0.5H), 5.26 (d, $J=4.5\text{Hz}$, 0
10 . 5H), 5.98 (m, 1H), 7.02 (m, 1H), 7.24 (m
, 5H), 7.73 (s, 0.5H), 7.91 (s, 0.5H).

実施例30 (3S)-3-((S)-2-(3,3-ジメチルブチリル
アミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランール (表-1の化合物番号73) の製造

15 融点: 152-153°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1642, 1549.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93 (m, 6H), 1.02 (s, 9
H), 1.49-1.94 (m, 4H), 2.07 (s, 1H), 2.0
8 (s, 1H), 2.32 (m, 0.5H), 2.45 (m, 0.5H)
20 . 3.17 (d, $J=3.0\text{Hz}$, 0.5H), 3.73 (d, $J=3.0\text{Hz}$,
0.5H), 3.87 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz ,
 7.8Hz , 0.5H), 4.02 (m, 0.5H), 4.10 (m, 1
H), 4.23-4.54 (m, 3H), 5.28 (d, $J=2.4\text{Hz}$
, 0.5H), 5.31 (dd, $J=2.4\text{Hz}$, 2.4Hz , 0.5H)
25), 6.62 (s, 0.5H), 6.69 (s, 0.5H).

実施例31 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-テトラデカノイ

ルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号78) の製造

融点: 96 - 98°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3292, 1636, 1543.

5 NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, $J=5.3\text{Hz}$; 3H),
0.94 (m, 6H), 1.25 (m, 2H), 1.51 - 1.94 (m, 4H), 2.20 (m, 2H), 2.31 (m, 0.5H), 2.43 (m, 0.5H), 3.10 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.5H), 3.65 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.5H), 3.87 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 4.00 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 4.11 (m, 1H), 4.26 - 4.55 (m, 2H), 5.27 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.5H), 5.31 (dd, $J=4.1\text{Hz}$, 4.1Hz, 0.5H), 5.97 (s, 1H), 6.52 (s, 0.5H), 6.62 (s, 0.5H).

15 実施例32 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (3 - フェニルプロピオニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号83) の製造

融点: 60 - 62°C

20 IR (KBr, cm^{-1}): 3291, 1644, 1549.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (m, 6H), 1.81 (m, 1H), 1.44 - 1.62 (m, 3H), 2.28 - 2.46 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.77 (s, 0.6H), 2.93 (m, 2H), 3.08 (s, 0.4H), 3.87 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.6H), 4.05 (ddd, $J=7.8\text{Hz}$, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.4H), 4.12 (m, 1H), 4

. 24-4.48 (m, 2H), 5.24 (s, 0.4H), 5.29 (m, 0.6H), 5.79 (m, 1H), 6.28 (d, J=7.5 Hz, 0.4H), 6.45 (d, J=7.5 Hz, 0.6H), 7.23 (m, 5H).

- 5 実施例 33 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-(1-ナフチルアセチルアミノ)バレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号85)の製造

融点: 164-167°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3279, 1638.

- 10 NMR (CDCl₃, +DMSO-d₆, δ): 0.76 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.78 (d, J=5.8 Hz, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.48 (m, 1H), 1.72 (m, 1H), 2.19 (m, 0.7H), 2.31 (m, 0.3H), 3.78 (ddd, J=8.0 Hz, 8.0 Hz, 8.0 Hz, 0.7H), 3.85 (ddd, J=8.0 Hz, 8.0 Hz, 8.0 Hz, 0.3H), 3.97-4.09 (m, 3H), 4.20 (m, 1H), 4.41 (m, 1H), 5.09 (d, J=4.0 Hz, 0.3H), 5.15 (d, J=3.7 Hz, 0.3H), 5.22 (dd, J=4.4 Hz, 4.4 Hz, 0.7H), 5.38 (d, J=4.3 Hz, 0.7H), 6.42 (d, J=7.8 Hz, 0.7H), 6.56 (d, J=9.0 Hz, 0.3H), 6.71 (d, J=7.4 Hz, 0.7H), 6.97 (d, J=7.2 Hz, 0.3H), 7.42-7.53 (m, 4H), 7.55-7.88 (m, 2H), 7.98 (d, J=7.4 Hz, 1H).

- 25 実施例 34 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノ)バレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号90)の製造

融点 : 30°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3297, 1653.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 (d, $J=6.0$ Hz, 3H),
0.92 (d, $J=5.7$ Hz, 3H), 1.55-1.70 (m, 2H)
5) , 1.84 (m, 2H), 2.32 (m, 0.6H), 2.45 (m,
0.4H), 3.87 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz, 7.8 Hz,
0.6H), 4.01 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz, 7.
8 Hz, 0.4H), 4.11 (m, 1H), 4.33 (m, 1H), 4
. 51 (s, 0.8H), 4.52 (s, 1.2H), 4.55 (m, 1
10 H), 5.28 (s, 0.4H), 5.33 (d, $J=4.5$ Hz, 0.
6H), 6.63 (d, $J=7.5$ Hz, 0.4H), 6.68 (d, J
= 8.1 Hz, 0.6H), 6.93 (m, 2H), 7.03 (m, 2H
) , 7.31 (m, 2H).

実施例 35 (3S) - 3 - { (S) - 2 - (2-クロロフェノキシアセ
15 チルアミノ) - 4 - メチルパレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフラノー
ル (表-1の化合物番号94) の製造

融点 : 49-52°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3302, 3074, 1655, 1537.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.94 (m, 6H), 1.60-1.9
20 1 (m, 4H), 2.31 (m, 0.7H), 2.45 (m, 0.3H)
, 3.27 (d, $J=2.7$ Hz, 0.3H), 3.72 (d, $J=2.$
7 Hz, 0.7H), 3.87 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz,
7.8 Hz, 0.7H), 4.06 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz,
7.8 Hz, 0.3H), 4.11 (m, 1H), 4.40 (m, 1
25 H), 4.52 (m, 1H), 4.52 (s, 0.6H), 4.57 (s
, 1.4H), 5.29 (s, 0.3H), 5.33 (dd, $J=3.6$

Hz, 3.6 Hz, 0.7 H), 6.49 (s, 0.3 H), 6.64 (s, 0.7 H), 6.90 (m, 1 H), 7.02 (m, 1 H), 7.26 (m, 2 H), 7.41 (m, 1 H).

5 実施例 36 (3S)-3-[(S)-2-(4-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランール (表-1の化合物番号96)の製造

融点: 53-55°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3301, 1653, 1541.

10 NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (m, 6H), 1.69-1.88 (m, 4H), 2.32 (m, 0.5H), 2.58 (m, 0.5H), 2.91 (d, $J=2.8\text{ Hz}$, 0.5H), 3.28 (d, $J=3.0\text{ Hz}$, 0.5H), 3.88 (ddd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 0.5H), 4.06 (ddd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 0.5H), 4.12 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.47 (s, 1H), 4.49 (s, 1H), 4.53 (m, 1H), 5.28 (d, $J=2.6\text{ Hz}$, 0.5H), 5.33 (dd, $J=4.5\text{ Hz}$, 4.5 Hz, 0.5H), 6.29 (s, 0.5H), 6.47 (s, 0.5H), 6.88 (m, 3H), 7.27 (m, 2H).

15 実施例 37 (3S)-3-[(S)-4-メチル-2-フェニルチオアセチルアミノバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランール (表-1の化合物番号110)の製造

融点: 45-47°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3287, 1645, 1551.

25 NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (m, 6H), 1.35 (m, 1H), 1.52 (m, 2H), 1.70 (m, 1H), 2.25 (m, 0.5H), 2.39 (m, 0.5H), 3.23 (s, 0.5H), 3.

6 6 (m, 2. 5H), 3. 8 5 (ddd, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 5H), 3. 9 6 (ddd, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 5H), 4. 0 9 (m, 1H), 4. 4 0-4. 4 2 (m, 2H), 5. 2 3 (d, J=2. 3 Hz, 0. 5H), 5. 2 8 (dd, J=3. 9 Hz, 3. 9 Hz, 0. 5H), 6. 3 9 (s, 0. 5H), 6. 5 3 (s, 0. 5H), 7. 1 0 (m, 1H), 7. 2 1 (m, 1H), 7. 2 9 (m, 3H), 7. 3 0 (s, 1H).

実施例 38 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-(3-フェニル
スルホニルプロピオニルアミノ)パレリルアミノ)-2-テトラヒドロフ
10 ラノール(表-1の化合物番号111)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3301, 1649, 1547.

NMR (CDCl₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 48-1. 7
4 (m, 5H), 1. 80-1. 92 (m, 1H), 2. 30 (m, 0.
5H), 2. 43 (m, 0. 5H), 2. 72 (m, 2H), 3. 41 (
15 m, 1H), 3. 52 (m, 1H), 3. 86 (ddd, J=8. 1 Hz,
8. 1 Hz, 8. 1 Hz, 0. 5H), 4. 02 (m, 0. 5H), 4.
09 (m, 2H), 4. 28-4. 48 (m, 2H), 5. 29 (s,
0. 5H), 5. 33 (dd, J=4. 2 Hz, 4. 2 Hz, 0. 5H)
, 6. 27 (s, 1H), 6. 46 (s, 0. 5H), 6. 58 (s, 0
20 . 5H), 7. 59 (m, 2H), 7. 69 (m, 1H), 7. 93 (d
d, J=7. 2 Hz, 5. 4 Hz, 2H).

実施例 39 (3S)-3-((S)-2-ベンゾイルアミノ-4-メチ
ルパレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号
112)の製造

25 融点: 154-156°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1665, 1636.

NMR (CDC1₃, δ) : 0.98 (d, J=5.5 Hz, 6H),
1.71 (m, 3H), 1.87 (m, 1H), 2.31 (m, 0.7H)
) , 2.42 (m, 0.3H), 3.16 (s, 0.3H), 3.60 (s,
0.7H), 3.87 (ddd, J=8.2 Hz, 8.2 Hz, 8.
5
2 Hz, 0.7H), 4.03 (ddd, J=7.5 Hz, 7.5 Hz,
7.5 Hz, 0.3H), 4.12 (ddd, J=8.6 Hz, 8.6 Hz,
3.5 Hz, 1H), 4.36 (m, 1H), 4.68 (m, 1H)
, 5.30 (s, 0.3H), 5.35 (d, J=4.7 Hz, 0.7H
) , 6.67-6.75 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 7.52
10 (m, 1H), 7.79 (m, 2H).

実施例40 (3S)-3-((S)-2-(2-フルオロベンゾイルア
ミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表
-1の化合物番号113)の製造

融点: 62-64°C

15 IR (KBr, cm⁻¹) : 3306, 1644, 1534.

NMR (CDC1₃, δ) : 0.80-1.07 (m, 6H), 1.5
9-2.01 (m, 4H), 2.40 (m, 1H), 3.82 (m, 1H
) , 3.97-4.20 (m, 1.6H), 4.24-4.45 (m, 1
. 4H), 4.68 (m, 1H), 5.31 (d, J=2.5 Hz, 0.
20 6H), 5.35 (dd, J=4.2 Hz, 4.1 Hz, 0.4H), 6
. 87 (m, 1H), 7.02-7.20 (m, 2H), 7.25 (m,
1H), 7.50 (m, 1H), 8.00 (m, 1H).

実施例41 (3S)-3-((S)-2-(3-フルオロベンゾイルア
ミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表
25 -1の化合物番号114)の製造

融点: 159-161°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3304, 3076, 1638, 1588,
1547.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87-1.07 (m, 6H), 1.6
1-1.98 (m, 4H), 2.39 (m, 1H), 3.39 (d, J=
5 2.6 Hz, 0.5H), 3.87 (m, 1H), 3.98-4.18 (m,
1.5H), 4.35 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 5.3
1 (d, J=2.6 Hz, 0.5H), 5.35 (dd, J=4.1 Hz
, 4.1 Hz, 0.5H), 6.71 (d, J=7.6 Hz, 0.5H)
, 6.76 (d, J=7.6 Hz, 0.5H), 6.90 (d, J=8.
10 2 Hz, 0.5H), 6.99 (d, J=8.2 Hz, 0.5H), 7.
20 20 (ddd, J=8.2 Hz, 8.2 Hz, 2.7 Hz, 1H), 7.
40 (m, 1H), 7.43-7.60 (m, 2H).

実施例42 (3S)-3-((S)-2-(4-フルオロベンゾイルア
ミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランール(表
15 -1の化合物番号115)の製造

融点: 151-153°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3422, 3301, 1640, 1545,
1503.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85-1.17 (m, 6H), 1.6
20 0-1.97 (m, 4H), 2.37 (m, 1H), 3.79 (d, J=
2.7 Hz, 0.55H), 3.87 (m, 0.55H), 4.06 (m
, 0.45H), 4.10 (m, 1H), 4.27 (ddd, J=6.8
Hz, 6.8 Hz, 2.1 Hz, 0.45H), 4.39 (m, 1H),
5.31 (d, J=2.7 Hz, 0.55H), 5.35 (d, J=4.
25 1 Hz, 4.1 Hz, 0.45H), 6.28 (d, J=8.3 Hz, 0
.45H), 6.96 (d, J=8.3 Hz, 0.55H), 7.02-

7. 19 (m, 3H), 7. 75-7. 89 (m, 2H).

実施例 43 (3S) - 3 - { (S) - 2 - (4-クロロベンゾイルアミノ) - 4-メチルバレリルアミノ } - 2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号121) の製造

5 融点: 93-96°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3295, 1636.

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 95 (d, $J=6. 0\text{ Hz}$, 3H),
0. 97 (d, $J=5. 7\text{ Hz}$, 3H), 1. 73 (m, 3H), 1. 8
6 (m, 1H), 2. 31 (m, 0. 7H), 2. 42 (m, 0. 3H)
10 . 3. 41 (s, 0. 3H), 3. 86 (s, 0. 7H), 3. 87 (d
dd, $J=8. 4\text{ Hz}$, 8. 4Hz, 8. 4Hz, 0. 7H), 4. 02
(ddd, $J=7. 8\text{ Hz}$, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 3H), 4.
12 (m, 1H), 4. 35 (m, 1H), 4. 68 (m, 1H), 5.
30 (s, 0. 3H), 5. 35 (d, $J=4. 5\text{ Hz}$, 0. 7H), 6
15 . 71 (d, $J=8. 1\text{ Hz}$, 0. 7H), 6. 76 (d, $J=6. 9\text{ Hz}$
z, 0. 3H), 6. 87 (d, $J=6. 4\text{ Hz}$, 0. 7H), 6. 95
(d, $J=8. 1\text{ Hz}$, 0. 3H), 7. 39 (dd, $J=8. 4\text{ Hz}$,
1. 8Hz, 2H), 7. 73 (dd, $J=8. 4\text{ Hz}$, 2. 1Hz, 2
H).

20 実施例 44 (3S) - 3 - { (S) - 4-メチル-2-(2-メチルベ
ンゾイルアミノ) バレリルアミノ } - 2-テトラヒドロフラノール (表-
1の化合物番号125) の製造

融点: 73-74°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1638, 1541.

25 NMR (CD_3OD , δ): 0. 98 (d, $J=6. 1\text{ Hz}$, 6H),
1. 50-1. 99 (m, 4H), 2. 30 (m, 1H), 2. 38 (s

, 1. 65 H), 2. 39 (s, 1. 35 H), 3. 85 (m, 0. 55 H), 3. 98-4. 17 (m, 1. 45 H), 4. 23 (m, 1 H), 4. 60 (m, 1 H), 5. 16 (s, 0. 55 H), 5. 25 (d, J = 4. 7 Hz, 0. 45 H), 7. 18-7. 29 (m, 2 H), 7. 30-7. 42 (m, 2 H).

実施例 45 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(3-メチルベンゾイルアミノ)パレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号126)の製造

融点: 85-87°C

10 IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1638, 1586, 1541.
NMR (CDCl_3 , δ): 0. 83-1. 07 (m, 6H), 1. 60-1. 97 (m, 3H), 2. 07 (m, 1H), 2. 30 (m, 1H), 2. 35 (s, 1. 8H), 2. 36 (s, 1. 2H), 3. 82 (m, 0. 6H), 3. 96-4. 18 (m, 1. 6H), 4. 18-4. 42 (m, 1. 4H), 4. 75 (m, 1H), 4. 93 (m, 0. 4H), 5. 31 (d, J=2. 9 Hz, 0. 6H), 5. 35 (dd, J=4. 4 Hz, 4. 3 Hz, 0. 4H), 7. 01 (m, 1H), 7. 14 (m, 1H), 7. 32-7. 40 (m, 2H), 7. 57-7. 67 (m, 2H).

20 実施例 46 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(4-メチルベンゾイルアミノ)パレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号127)の製造

融点: 101-102°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3304, 1634, 1545, 1504.
25 NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87-1. 07 (m, 6H), 1. 60-1. 95 (m, 4H), 2. 37 (m, 1H), 2. 39 (s, 3H)

), 3.45 (d, $J=2.9$ Hz, 0.6H), 3.90 (m, 0.4H), 3.97-4.19 (m, 2H), 4.38 (m, 1H), 4.71 (m, 1H), 5.30 (d, $J=2.9$ Hz, 0.6H), 5.35 (dd, $J=6.7$ Hz, 6.7 Hz, 0.6H), 6.74 (d, $J=8.5$ Hz, 0.4H), 6.80 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 6.89 (d, $J=6.7$ Hz, 0.6H), 7.22 (d, $J=8.2$ Hz, 2H), 7.68 (d, $J=8.2$ Hz, 2H).

実施例47 (3S)-3-{(S)-2-(2,6-ジメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール

10 (表-1の化合物番号129)の製造

融点: 89-91°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3389, 1638, 1539.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83-1.10 (m, 6H), 1.58-1.99 (m, 4H), 2.25 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 15 2.32 (m, 1H), 3.65-3.93 (m, 1.55H), 4.07 (m, 1H), 4.22-4.45 (m, 1.45H), 4.70 (m, 1H), 5.25 (d, $J=3.1$ Hz, 0.55H), 5.31 (dd, $J=4.3$ Hz, 4.2 Hz, 0.45H), 6.36 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 6.85-7.07 (m, 3H), 7.14 (d, 20 d, $J=7.8$ Hz, 7.3 Hz, 1H).

実施例48 (3S)-3-{(S)-2-(3,4-ジメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール

(表-1の化合物番号130)の製造

融点: 92-94°C

25 IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1636, 1541.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83-1.10 (m, 6H), 1.5

7-1.99 (m, 4H), 2.28 (s, 3H), 2.29 (s, 3H),
2.34 (m, 1H), 3.57 (s, 0.5H), 3.86 (m,
0.5H), 3.97-4.20 (m, 1.5H), 4.21-4.45
(m, 1.5H), 4.70 (m, 1H), 5.31 (s, 0.5H),
5.35 (d, J=2.1Hz, 0.5H), 6.74 (d, J=8.3
Hz, 0.5H), 6.80 (d, J=8.2Hz, 0.5H), 6.8
5 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 6.93 (d, J=7.1Hz,
0.5H), 7.17 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.43-7.6
0 (m, 2H).

10 実施例49 (3S)-3-[(S)-4-メチル-2-(2,4,6-
トリメチルベンゾイルアミノ)バレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラ
ノール(表-1の化合物番号131)の製造

融点: 150-152°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3295, 1638, 1522.

15 NMR (CDCl₃, δ): 0.87-1.07 (m, 6H), 1.5
8-1.97 (m, 4H), 2.18-2.35 (m, 9H), 2.36
(m, 1H), 3.09 (s, 0.45H), 3.48 (s, 0.55H
) , 3.85 (m, 0.55H), 3.97-4.20 (m, 1.45H
) , 4.35 (m, 1H), 4.65 (m, 1H), 5.29 (d, J=
20 2.5Hz, 0.45H), 5.34 (dd, J=4.1Hz, 3.8H
z, 0.55H), 6.08 (d, J=5.2Hz, 1H), 6.75 (
m, 1H), 6.83 (s, 2H).

実施例50 (3S)-3-[(S)-2-(4-エチルベンゾイルアミ
ノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラノール(表-
25 1の化合物番号134)の製造

融点: 98-99°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3304, 1672, 1634, 1545,
1505.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.83-1.05 (m, 6H), 1.23 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 3H), 1.60-1.99 (m, 4H), 2.38 (m, 1H), 2.68 (q, $J=7.6\text{ Hz}$, 2H), 3.34 (s, 0.4H), 3.87 (m, 1H), 4.00-4.20 (m, 1.6H), 4.35 (m, 1H), 4.68 (m, 1H), 5.30 (s, 0.6H), 5.34 (d, $J=3.7\text{ Hz}$, 0.4H), 6.65-6.90 (m, 2H), 7.21-7.27 (m, 2H), 7.69-7.74 (m, 2H).

実施例 51 (3S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (4 - トリフルオロメチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフランオール (表-1の化合物番号137) の製造

融点 : 135 - 136°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1640, 1548, 1508.
NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87-1.07 (m, 6H), 1.61-1.97 (m, 4H), 2.37 (m, 1H), 3.43 (s, 0.4H), 3.82-4.08 (m, 1.6H), 4.17 (m, 1H), 4.29 (m, 1H), 4.70 (m, 1H), 5.31 (d, $J=2.6\text{ Hz}$, 0.4H), 5.36 (d, $J=4.2\text{ Hz}$, 4.2Hz, 0.6H), 6.71 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 0.6H), 6.73 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 0.4H), 7.03 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 0.6H), 7.14 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 0.4H), 7.61-7.86 (m, 2H), 7.87-7.93 (m, 2H).

実施例 52 (3S) - 3 - { (S) - 2 - (2 - メトキシベンゾイルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフランオール (表

- 1 の化合物番号 138) の製造

融点: 65 - 66 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3376, 1640, 1601, 1532.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 - 1.05 (m, 6H), 1.6
5 0 - 1.95 (m, 4H), 2.31 (m, 1H), 3.85 (m, 0.
6H), 3.98 (s, 3H), 4.00 - 4.20 (m, 1.6H),
4.24 - 4.45 (m, 1.4H), 4.69 (m, 1H), 5.00
(m, 0.4H), 5.34 (m, 1H), 6.93 - 7.17 (m, 2
10 .4H), 7.22 (m, 0.6H), 7.50 (m, 1H), 8.15
(m, 1H), 8.30 (m, 1H).

実施例 53 (3S) - 3 - { (S) - 2 - (4 - メトキシベンゾイルア
ミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフラノール (表
- 1 の化合物番号 140) の製造

融点: 85 - 88 °C

15 IR (KBr, cm^{-1}): 3295, 1632.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.95 (d, $J=6.0\text{ Hz}$, 3H),
0.96 (d, $J=4.8\text{ Hz}$, 3H), 1.72 (m, 3H), 1.8
6 (m, 1H), 2.29 (m, 0.5H), 2.40 (m, 0.5H)
, 3.84 (s, 3H), 3.86 (ddd, $J=8.1\text{ Hz}$, 8.1H
20 z, 8.1Hz, 0.5H), 4.01 (ddd, $J=8.1\text{ Hz}$, 8.
1Hz, 8.1Hz, 0.5H), 4.08 (m, 1H), 4.28 (m
, 0.5H), 4.35 (m, 0.5H), 4.68 (m, 1H), 5.
30 (s, 0.5H), 5.34 (d, $J=4.8\text{ Hz}$, 0.5H), 6
.71 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 0.5H), 6.78 (d, $J=8.4\text{ Hz}$
25 z, 0.5H), 6.82 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 0.5H), 6.91
(dd, $J=9.0\text{ Hz}$, 2.4Hz, 2H), 6.94 (d, $J=8.$

7 Hz, 0.5 H), 7.76 (m, 2H).

実施例54 (3S)-3-{(S)-2-(2,4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号141)の製造

5 融点: 65-67°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3382, 1638, 1604, 1534.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83-1.05 (m, 6H), 1.59-1.98 (m, 4H), 2.40 (m, 1H), 3.83 (m, 0.6H), 3.84 (s, 1.2H), 3.86 (s, 1.8H), 3.95 (s, 1.8H), 3.97 (s, 1.2H), 4.00-4.21 (m, 2H), 4.35 (m, 1H), 4.65 (m, 1H), 4.80 (m, 0.4H), 5.32 (d, $J=3.2\text{ Hz}$, 0.6H), 5.35 (dd, $J=4.6\text{ Hz}$, 4.6 Hz, 0.5H), 6.48 (s, 0.4H), 6.49 (s, 0.6H), 6.59 (m, 1H), 6.99 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 0.6H), 7.15 (d, $J=6.7\text{ Hz}$, 0.4H), 8.07-8.22 (m, 2H).

実施例55 (3S)-3-{(S)-2-(2,6-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号142)の製造

20 融点: 166-168°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 3279, 1645, 1597, 1508.

NMR ($\text{DMSO}-d_6$, δ): 0.87 (d, $J=6.2\text{ Hz}$, 6H), 1.38-1.60 (m, 2H), 1.60-1.83 (m, 2H), 2.15 (m, 1H), 3.65 (m, 1H), 3.71 (s, 2.4H), 3.72 (s, 3.6H), 3.93 (m, 1H), 4.10 (m

, 1 H), 4. 39 (m, 1 H), 5. 14 (m, 1 H), 6. 55 (m, 1 H), 6. 58-6. 70 (m, 2 H), 7. 18 (d, J=5. 7 Hz, 1 H), 7. 29 (m, 1 H), 8. 33 (d, J=8. 4 Hz, 1 H).

5 実施例 56 (3S)-3-((S)-2-(3,5-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランール(表-1の化合物番号144)の製造

融点: 88-90°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3407, 1639, 1595, 1539.

10 NMR (CDCl_3 , δ): 0. 83-1. 05 (m, 6H), 1. 60-1. 98 (m, 4H), 2. 40 (m, 1H), 3. 41 (s, 0. 6H), 3. 70-3. 93 (m, 0. 8H), 3. 79 (s, 6H), 3. 95-4. 08 (m, 0. 6H), 4. 10 (m, 1H), 4. 25 (m, 1H), 4. 65 (m, 1H), 5. 30 (d, J=2. 2 Hz, 0. 6H), 5. 34 (m, 0. 4H), 6. 58 (dd, J=1. 9 Hz, 1. 9 Hz, 1H), 6. 67-6. 87 (m, 2H), 6. 87-6. 97 (m, 2H).

15 実施例 57 (3S)-3-((S)-2-(4-エトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランール(表-1の化合物番号148)の製造

融点: 84-85°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1634, 1609, 1547, 1504.

25 NMR (CDCl_3 , δ): 0. 83-1. 07 (m, 6H), 1. 43 (t, J=7. 0 Hz, 3H), 1. 60-1. 99 (m, 4H), 2. 38 (m, 1H), 3. 82 (m, 1H), 3. 92-4. 20 (m,

3. 5 H), 4. 5 5 (s, 0. 5 H), 4. 6 9 (m, 1 H), 5. 3
1 (d, J=2. 8 Hz, 0. 5 H), 5. 3 5 (dd, J=4. 3 Hz
, 4. 1 Hz, 0. 5 H), 6. 8 0 (d, J=8. 3 Hz, 0. 5 H)
5 . 6. 8 4-7. 0 0 (m, 3 H), 7. 1 4 (d, J=7. 0 Hz, 0
. 5 H), 7. 7 6 (d, J=8. 7 Hz, 2 H).

実施例 5 8 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-(3,4-メチ
レンジオキシベンゾイルアミノ)バレルルアミノ)-2-テトラヒドロフ
ラノール(表-1の化合物番号152)の製造

融点: 94-96°C

10 IR (KBr, cm^{-1}): 3410, 3111, 1753, 1659.
NMR (CDCl_3 , δ): 0. 95 (d, J=6. 0 Hz, 3 H),
0. 96 (d, J=5. 1 Hz, 3 H), 1. 69-1. 81 (m, 3 H
) , 1. 86 (m, 1 H), 2. 30 (m, 0. 5 H), 2. 41 (m,
0. 5 H), 3. 89 (ddd, J=8. 1 Hz, 8. 1 Hz, 8. 1 H
15 z, 0. 5 H), 4. 05 (ddd, J=7. 6 Hz, 7. 6 Hz, 7.
6 Hz, 0. 5 H), 4. 11 (m, 1 H), 4. 30 (m, 0. 5 H)
, 4. 36 (m, 0. 5 H), 4. 64 (m, 1 H), 5. 30 (s, 0
. 5 H), 5. 32 (d, J=4. 6 Hz, 0. 5 Hz), 6. 02 (s
, 2 H), 6. 61-6. 80 (m, 2 H), 6. 82 (d, J=7. 8
20 Hz, 1 H), 7. 28 (dd, J=2. 7 Hz, 2. 7 Hz, 1 H),
7. 33 (ddd, J=8. 0 Hz, 2. 0 Hz, 2. 0 Hz, 1 H).

実施例 5 9 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-(1-ナフトイ
ルアミノ)バレルルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化
合物番号156)の製造

25 融点: 85-86°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1638, 1535.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.83-1.05 (m, 6H), 1.59-1.99 (m, 4H), 2.38 (m, 1H), 3.47 (s, 0.45H), 3.88 (m, 1H), 3.94-4.20 (m, 1.55H), 4.38 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 5.29 (d, J=2.9 Hz, 0.55H), 5.35 (dd, J=4.4 Hz, 3.9 Hz, 0.45H), 6.64 (d, J=8.2 Hz, 0.55H), 6.73 (d, J=8.1 Hz, 0.45H), 6.89 (m, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.47-7.68 (m, 3H), 7.80-7.97 (m, 2H), 8.25 (m, 1H).

10 実施例60 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-ナフトイルアミノ)バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号157)の製造

融点: 98-100°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3293, 1640, 1539, 1512.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0.83-1.13 (m, 6H), 1.60-1.99 (m, 4H), 2.36 (m, 1H), 3.53 (s, 0.3H), 3.85 (m, 0.7H), 3.99-4.21 (m, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 5.34 (dd, J=4.4 Hz, 4.3 Hz, 0.3H), 5.38 (d, J=2.7 Hz, 0.7H), 6.88 (d, J=8.5 Hz, 0.7H), 6.96 (d, J=7.2 Hz, 0.3H), 7.04 (d, J=8.3 Hz, 0.7H), 7.12 (d, J=8.2 Hz, 0.3H), 7.43-7.64 (m, 2H), 7.79-7.97 (m, 4H), 8.32 (s, 1H).

20 実施例61 (3S)-3-{(S)-2-(2-フロイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号161)の製造

融点：92-95℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3420, 3300, 1645, 1595,
1529.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85-1.05 (m, 6H), 1.5
5 8-2.00 (m, 4H), 2.25-2.55 (m, 1H), 3.52
(d, $J=2.7\text{ Hz}$, 0.55H), 3.87 (dt, $J=7.8\text{ Hz}$
, 7.8 Hz, 0.55H), 3.95-4.17 (m, 1.9H), 4
. 27-4.45 (m, 1H), 4.45-4.73 (m, 1H), 5.
31 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 0.55H), 5.35 (dd, $J=4.0$
10 Hz, 4.0 Hz, 0.45H), 6.51 (dd, $J=3.1\text{ Hz}$, 1
. 4 Hz, 1H), 6.77 (d, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 6.80-
6.93 (m, 1H), 7.14 (dd, $J=3.1\text{ Hz}$, 1.9 Hz,
1H), 7.46 (dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 1.4 Hz, 1H).

実施例62 (3S)-3-{(S)-2-(3-エチル-1-メチル-
15 5-ピラゾール)カルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ}-2-
テトラヒドロフランール(表-1の化合物番号170)の製造

融点：89-91℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3301, 1643.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.97 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 6H),
20 1.23 (t, $J=7.7\text{ Hz}$, 2.1H), 1.23 (t, $J=7.6$
Hz, 0.9H), 1.60-1.90 (m, 4H), 2.34 (m, 0
. 7H), 2.56 (m, 0.3H), 2.62 (q, $J=7.6\text{ Hz}$,
2H), 3.89 (ddd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz,
1H), 4.01-4.17 (m, 2H), 4.08 (s, 0.9H),
25 4.08 (s, 2.1H), 4.35 (m, 1H), 4.58 (m, 1H
) , 5.29 (s, 0.3H), 5.35 (d, $J=3.9\text{ Hz}$, 0.7

H), 6.39 (s, 1H), 6.44 (d, J=6.8 Hz, 0.3H), 6.55 (d, J=8.4 Hz, 0.7H), 6.60 (d, J=8.4 Hz, 1H).

5 実施例63 (3S)-3-((S)-2-(2-クロマンカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号175)の製造

融点: 84-85°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1786, 1532.

10 NMR (CDCl_3 , δ): 0.78-0.93 (m, 3H), 0.95-1.05 (m, 3H), 1.35-2.07 (m, 5H), 2.20-2.54 (m, 2H), 2.70-3.00 (m, 2H), 3.80-4.20 (m, 2H), 4.24-4.60 (m, 3H), 5.15 (m, 1H), 5.31 (m, 1H), 6.40 (m, 1H), 6.65 (m, 1H), 6.83-6.97 (m, 2H), 6.98-7.20 (m, 15 2H).

実施例64 (3S)-3-((S)-2-シンナモイルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号182)の製造

融点: 102-104°C

20 IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1651, 1624, 1543.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.96 (m, 6H), 1.63-1.92 (m, 4H), 2.32 (m, 0.5H), 2.47 (m, 0.5H), 3.35 (d, J=2.7 Hz, 0.5H), 3.43 (d, J=2.7 Hz, 0.5H), 3.92 (m, 1H), 4.02-4.18 (m, 25 2H), 4.34 (m, 1H), 4.62 (m, 1H), 5.31 (s, 0.5H), 5.35 (m, 0.5H), 6.43 (d, J=15.0 Hz,

z, 1H), 6.44 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 7.32 (m, 2H), 7.51 (m, 2H), 7.62 (m, 1H).

実施例65 (3S)-3-{(S)-2-(4-メトキシシナモイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラン(

5 表-1の化合物番号187)の製造

融点: 101-103°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3283, 1651, 1602, 1543, 1512.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85-1.05 (m, 6H), 1.6
10 0-1.99 (m, 4H), 2.30 (m, 1H), 3.77 (s, 1.5H), 3.79 (s, 1.5H), 3.82 (m, 0.5H), 4.10 (m, 1H), 4.30 (m, 0.5H), 4.41 (m, 1H), 4.72 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 6.38 (d, $J=15.6$ Hz, 0.5H), 6.41 (d, $J=15.6$ Hz, 0.5H), 6
15 .65-6.85 (m, 2H), 6.90 (d, $J=8.5$ Hz, 0.5H), 7.15 (d, $J=8.5$ Hz, 0.5H), 7.20 (d, $J=8.5$ Hz, 0.5H), 7.43 (dd, $J=8.8$ Hz, 3.1 Hz, 2H), 7.49 (d, $J=8.5$ Hz, 0.5H), 7.58 (d, $J=15.6$ Hz, 0.5H), 7.59 (d, $J=15.6$ Hz, 0.
20 5H).

実施例66 (3S)-3-{(S)-2-(4-フルオロフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラン(表-1の化合物番号202)の製造

融点: 156-158°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3347, 3256, 1649, 1593, 1541.

NMR (DMSO-d₆, δ) : 0.71 (d, J=6.5 Hz, 3H), 0.80 (d, J=6.6 Hz, 3H), 1.28 (m, 2H), 1.45-1.68 (m, 2H), 1.86 (m, 1H), 3.60-3.95 (m, 4H), 4.98 (dd, J=4.4 Hz, 4.1 Hz, 1H), 5.37 (d, J=4.1 Hz, 1H), 7.39 (dd, J=8.8 Hz, 8.3 Hz, 2H), 7.75 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.81 (dd, J=8.8 Hz, 5.3 Hz, 2H), 8.00 (d, J=9.0 Hz, 1H).

実施例67 (3S)-3-[(S)-2-(2-クロロフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号203) の製造

IR (KBr, cm⁻¹) : 3365, 1657, 1541.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.65 (d, J=6.2 Hz, 1.2H), 0.67 (d, J=6.4 Hz, 1.8H), 0.82 (d, J=6.1 Hz, 1.2H), 0.84 (d, J=6.4 Hz, 1.8H), 1.43-1.72 (m, 4H), 2.13 (m, 0.6H), 2.36 (m, 0.4H), 3.62-4.28 (m, 5H), 5.24 (d, J=3.0 Hz, 0.4H), 5.31 (dd, J=3.8 Hz, 3.8 Hz, 0.6H), 5.91 (d, J=8.8 Hz, 0.4H), 5.94 (d, J=7.9 Hz, 0.6H), 6.47 (d, J=7.5 Hz, 0.4H), 6.65 (d, J=8.1 Hz, 0.6H), 7.38-7.45 (m, 1H), 7.45-7.60 (m, 2H), 8.06 (dd, J=7.3 Hz, 1.1 Hz, 1H).

実施例68 (3S)-3-[(S)-2-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号205) の製造

融点：112-115℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3335, 3264, 1649.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.76 (d, J=6.3Hz, 0.6H), 0.80 (d, J=6.3Hz, 2.4H), 0.87 (d, J=6.9Hz, 0.6H), 0.89 (d, J=6.6Hz, 2.4H), 1.48 (m, 3H), 1.68 (m, 1H), 2.11 (m, 0.8H), 2.40 (m, 0.2H), 3.67 (ddd, J=6.9Hz, 6.9Hz, 6.9Hz, 1H), 3.85 (m, 0.8H), 3.94 (m, 0.2H), 4.05-4.21 (m, 2H), 5.18 (s, 0.2H), 5.25 (d, J=4.5Hz, 0.8H), 5.31 (d, J=9.9Hz, 0.2H), 5.35 (d, J=8.4Hz, 0.8H), 5.94 (d, J=7.8Hz, 0.2H), 6.23 (d, J=7.8Hz, 0.8H), 7.48 (d, J=8.4Hz, 2H), 7.80 (d, J=8.4Hz, 2H).

15 実施例69 (3S)-3-((S)-2-(4-ブロモフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランール(表-1の化合物番号208)の製造

融点：139-140℃

20 IR (KBr, cm^{-1}) : 3478, 3362, 3264, 1647, 1576, 1537.

NMR (DMSO-d₆, δ) : 0.63-0.90 (m, 6H), 1.15-1.42 (m, 2H), 1.42-1.66 (m, 2H), 1.83 (m, 0.65H), 2.02 (m, 0.35H), 3.45-3.92 (m, 4H), 4.80 (d, J=4.1Hz, 0.35H), 4.96 (dd, J=4.4Hz, 4.4Hz, 0.65H), 6.10 (d, J=4.1Hz, 0.35H), 6.36 (d, J=4.4Hz, 0.

6 5 H), 7. 6 0-7. 8 5 (m, 4. 6 5 H), 7. 9 5-8. 1 5
(m, 1. 3 5 H).

実施例 7 0 (3 S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (4 - メチルフェ
ニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロフラノ
5 ル (表 - 1 の化合物番号 2 1 1) の製造

融点: 1 3 7 - 1 3 8 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3 3 4 3, 3 2 6 4, 1 6 4 9, 1 5 4 1.

NMR (DMSO- d_6 , δ): 0. 6 6 (d, $J=6. 5$ Hz, 0.
9 H), 0. 7 4 (d, $J=6. 7$ Hz, 3 H), 0. 8 0 (d, $J=6$
10 . 7 Hz, 2. 1 H), 1. 1 0-1. 4 0 (m, 3 H), 1. 5 3 (m
, 1 H), 1. 8 5 (m, 0. 3 H), 1. 9 8 (m, 0. 7 H), 2.
3 5 (s, 3 H), 3. 5 1 (m, 0. 7 H), 3. 5 8-3. 8 5 (m
, 3. 3 H), 4. 7 8 (d, $J=4. 4$ Hz, 0. 7 H), 4. 9 6 (
m, 0. 3 H), 6. 0 7 (d, $J=4. 4$ Hz, 0. 7 H), 6. 3 9
15 (d, $J=3. 9$ Hz, 0. 3 H), 7. 3 1 (d, $J=7. 9$ Hz, 2
H), 7. 6 1 (d, $J=7. 9$ Hz, 2 H), 7. 6 6 (d, $J=6.$
2 Hz, 0. 3 H), 7. 8 0 (m, 1 H), 7. 9 2 (d, $J=6. 4$
Hz, 0. 7 H).

実施例 7 1 (3 S) - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (2, 4, 6 -
20 トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒ
ドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 2 1 5) の製造

融点: 7 5 - 7 7 °C

IR (KBr, cm^{-1}): 3 3 2 8, 1 6 5 7, 1 6 0 5, 1 5 4 1.

NMR (CDCl $_3$, δ): 0. 6 7 (d, $J=6. 3$ Hz, 1. 3 5
25 H), 0. 6 8 (d, $J=6. 3$ Hz, 1. 6 5 H), 0. 8 3 (d, J
= 6. 4 Hz, 1. 3 5 H), 0. 8 4 (d, $J=6. 4$ Hz, 1. 6 5

H), 1. 38-1. 72 (m, 4H), 2. 11 (m, 0. 65H),
2. 29 (s, 3H), 2. 31 (m, 0. 45H), 2. 63 (s, 6
H), 3. 61 (m, 1H), 3. 72 (d, J=3. 0Hz, 0. 45
H), 3. 74-3. 98 (m, 1H), 3. 98-4. 24 (m, 2.
5 55H), 5. 23 (d, J=3. 0Hz, 0. 45H), 5. 28 (d
, J=3. 9Hz, 3. 9Hz, 0. 55H), 5. 46 (d, J=8.
6Hz, 0. 45H), 5. 60 (d, J=8. 0Hz, 0. 55H),
6. 38 (d, J=7. 4Hz, 0. 45H), 6. 54 (d, J=8.
0Hz, 0. 55H), 6. 95 (s, 2H).

10 実施例72 (3S)-3-[(S)-2-(4-tert-ブチルフェ
ニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒド
ロフランール(表-1の化合物番号218)の製造

融点: 140-141°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3362, 3161, 1647, 1535.

15 NMR (DMSO-d₆, δ): 0. 74 (d, J=6. 5Hz, 3H
, 0. 81 (d, J=6. 6Hz, 3H), 1. 15-1. 41 (m,
3H), 1. 29 (s, 9H), 1. 54 (m, 1H), 1. 95 (m,
1H), 3. 46 (m, 1H), 4. 62-4. 82 (m, 3H), 4.
80 (d, J=4. 3Hz, 1H), 6. 06 (d, J=4. 3Hz, 1
20 H), 7. 53 (d, J=8. 5Hz, 2H), 7. 66 (d, J=8.
5Hz, 2H), 7. 82 (d, J=9. 4Hz, 1H), 7. 95 (d
, J=6. 7Hz, 1H).

実施例73 (3S)-3-[(S)-2-(4-メトキシフェニルスル
ホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラノ
25 ール(表-1の化合物番号221)の製造

融点: 153-155°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3362, 3150, 1647, 1597, 1535, 1501.

NMR (DMSO- d_6 , δ) : 0.69 (m, 0.6H), 0.76 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 2.7H), 0.82 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 2.7H), 1.15-1.45 (m, 3H), 1.56 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 3.54 (m, 1H), 3.60-3.90 (m, 3H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (d, $J=4.6\text{Hz}$, 0.9H), 4.99 (m, 0.1H), 6.09 (d, $J=4.6\text{Hz}$, 0.9H), 6.41 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.1H), 7.04 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 2H), 7.60-7.80 (m, 3.1H), 7.94 (d, $J=6.9\text{Hz}$, 0.9H).

実施例74 (3S)-3-[(S)-4-メチル-2-(3-ニトロフェニルスルホニルアミノ)バレリルアミノ]-2-テトラヒドロフラン-1-オール (表-1の化合物番号227)の製造

15 融点 : 164-165 $^{\circ}\text{C}$

IR (KBr, cm^{-1}) : 3358, 3264, 1649, 1537.

NMR (DMSO- d_6 , δ) : 0.73-0.95 (m, 6H), 1.20-1.80 (m, 4.75H), 1.95 (m, 0.25H), 3.47-3.65 (m, 2H), 3.77 (m, 1H), 3.94 (m, 1H), 4.73 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.25H), 4.92 (dd, $J=4.1\text{Hz}$, 4.1Hz, 0.75H), 6.06 (d, $J=2.7\text{Hz}$, 0.25H), 6.29 (d, $J=4.1\text{Hz}$, 0.75H), 7.80-7.95 (m, 2H), 8.05-8.21 (m, 1.25H), 8.35 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 0.75H), 8.46 (d, $J=7.9\text{Hz}$, 1H), 8.50 (s, 1H).

25 実施例75 (3S)-3-[(S)-4-メチル-2-(1-ナフチル

スルホニルアミノ)パレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号229)の製造

融点: 89-91°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3580, 3520, 3470, 3281,
5 1647, 1553.

NMR (DMSO- d_6 , δ): 0.34 (d, $J=6.0$ Hz, 1.95H), 0.51 (d, $J=6.2$ Hz, 1.05H), 0.62 (d, $J=6.1$ Hz, 1.95H), 0.71 (d, $J=6.4$ Hz, 1.05H), 1.10-1.60 (m, 4H), 1.75-1.95 (m,
10 1H), 3.47-3.83 (m, 4H), 4.73 (d, $J=4.5$ Hz, 0.35H), 4.94 (dd, $J=4.3$ Hz, 4.3 Hz, 0.65H), 6.03 (d, $J=4.5$ Hz, 0.35H), 6.34 (d, $J=4.3$ Hz, 0.65H), 7.50-7.75 (m, 4H), 7.86 (d, $J=8.2$ Hz, 0.35H), 7.98-8.32 (m,
15 3.65H), 8.66 (d, $J=7.4$ Hz, 1H).

実施例76 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-ナフチルスルホニルアミノ)パレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号230)の製造

融点: 102-104°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3351, 1655, 1541.
20

NMR (DMSO- d_6 , δ): 0.65 (d, $J=6.4$ Hz, 1.5H), 0.65-0.90 (m, 4.5H), 1.14-1.68 (m, 5H), 3.25 (m, 0.5H), 3.57-3.91 (m, 3.5H), 4.73 (s, 0.5H), 4.89 (dd, $J=4.3$ Hz, 4.3 Hz, 0.5H), 5.98 (s, 0.5H), 6.32 (d, $J=4.3$ Hz, 0.5H), 7.60-7.80 (m, 3.5H), 7.9
25

3 (d, $J=6.7$ Hz, 0.5 H), 7.98–8.17 (m, 4 H),
8.38 (d, $J=8.3$ Hz, 1 H).

実施例 77 (3S)–3–{(S)–4–メチル–2–(3–ピリジル
スルホニルアミノ)パレリルアミノ}–2–テトラヒドロフラノール (表
5 –1の化合物番号 232) の製造

融点: 127–130°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3268, 1647.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.79 (d, $J=6.3$ Hz, 0.6 H),
0.84 (d, $J=6.6$ Hz, 2.4 H), 0.86 (d, $J=6$
10 . 0 Hz, 0.6 H), 0.90 (d, $J=6.6$ Hz, 2.4 H), 1.
. 49–1.61 (m, 3 H), 1.71 (m, 1 H), 2.09 (m,
0.8 H), 2.37 (m, 0.2 H), 3.78–3.87 (m, 1.
8 H), 3.96 (q, $J=6.6$ Hz, 0.2 H), 4.05–4.1
5 (m, 2 H), 5.17 (s, 0.2 H), 5.22 (d, $J=4.8$
15 Hz, 0.8 Hz), 5.75 (d, $J=8.7$ Hz, 0.8 H), 5.
79 (d, $J=9.3$ Hz, 0.2 H), 6.13 (d, $J=6.6$ Hz
, 0.2 H), 6.36 (d, $J=8.1$ Hz, 0.8 H), 7.45 (d
d, $J=7.8$ Hz, 4.8 Hz, 1 H), 8.17 (ddd, $J=7$
. 8 Hz, 1.8 Hz, 1.8 Hz, 1 H), 8.80 (dd, $J=4.$
20 8 Hz, 1.2 Hz, 1 H), 9.07 (d, $J=2.1$ Hz, 1 H).

実施例 78 (3S)–3–((S)–2–ベンジロキシカルボニルアミ
ノ–3–フェニルプロピオニルアミノ)–2–テトラヒドロフラノール (表
–1の化合物番号 246) の製造

融点: 144–146°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3302, 1696, 1649, 1537.

NMR (CDCl_3 , δ): 1.69 (m, 1 H), 2.20–2.4

1 (m, 1H), 2.60 (s, 0.8H), 2.82 (s, 0.2H),
2.97 (dd, J=14.7Hz, 7.8Hz, 1H), 3.13 (m, 1H), 3.81 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.8H), 4.02 (m, 1.2H), 4.26 (m, 1H), 4.37 (m, 1H), 5.09 (m, 3H), 5.40 (s, 1H), 5.70 (s, 0.2H), 6.08 (s, 0.8H), 7.33 (m, 10H).

実施例79 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-tert-ブトキシプロピオニルアミノ)-2-テトラヒドロフランオール (表-1の化合物番号297)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3322, 1719, 1661, 1534.
NMR (CDCl_3 , δ): 1.17 (s, 9H), 1.69-1.98 (m, 1H), 2.30 (m, 0.6H), 2.44 (m, 0.4H), 3.40 (m, 1H), 3.62-3.98 (m, 3H), 4.11 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.35 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.22 (s, 0.4H), 5.29 (s, 0.6H), 5.76 (s, 1H), 6.80 (s, 0.4H), 7.08 (bs, 0.6H), 7.35 (m, 5H).

実施例80 (3S)-4-メチル-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフランオール (表-1の化合物番号320)の製造

融点: 116-121°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3356, 3272, 1655.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.70 (d, J=6.0Hz, 2.1H), 0.71 (d, J=6.0Hz, 0.9H), 0.86 (d, J=6.6Hz, 3H), 0.95 (d, J=6.6Hz, 2.1H), 1.0

4 (d, $J=6.6$ Hz, 0.9 H), 1.50 (m, 2H), 1.62 (m, 1H), 2.12 (m, 1H), 3.43 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.91 (m, 1H), 4.17 (dd, $J=8.4$ Hz, 8.4 Hz, 1H), 5.12 (d, $J=4.5$ Hz, 0.3H), 5.25 (d, $J=4.5$ Hz, 0.7H), 5.35 (d, $J=7.2$ Hz, 0.7H), 5.40 (d, $J=7.2$ Hz, 0.3H), 6.34 (d, $J=8.7$ Hz, 0.3H), 6.37 (d, $J=8.7$ Hz, 0.7H), 7.49-7.62 (m, 3H), 7.88 (m, 2H).

10 実施例 81 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロピラゾール (表-1 の化合物番号 433) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3298, 1691, 1649, 1541.

15 NMR (CDCl_3 , δ): 0.90-0.92 (m, 6H), 1.57-1.70 (m, 7H), 3.43-3.70 (m, 2H), 3.87-3.99 (m, 2H), 4.08-4.12 (m, 1H), 5.02 (s, 0.4H), 5.08 (s, 1.6H), 5.66 (s, 1H), 6.57 (s, 0.8H), 6.88 (s, 0.2H), 7.31 (s, 5H).

20 実施例 82 (3S)-3-((S)-2-(2-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルバリレルアミノ)-2-テトラヒドロピラゾール (表-1 の化合物番号 450) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3408, 1600, 1495.

25 NMR (CDCl_3 , δ): 0.92-0.98 (m, 6H), 1.64-1.82 (m, 7H), 3.48-3.59 (m, 2H), 3.84-4.13 (m, 2H), 4.68-4.70 (m, 1H), 5.01 (m, 0.3H), 5.05 (m, 0.7H), 6.55 (d, $J=8.3$

Hz, 0.7H), 6.82 (d, $J=8.2$ Hz, 0.3H), 7.07-7.28 (m, 2H), 7.41-7.52 (m, 1H), 7.99-8.05 (m, 1H).

5 実施例83 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロピラノール(表-1の化合物番号468)の製造

融点: 156-157°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3335, 3261, 1649, 1545.

10 NMR (CDCl_3 , δ): 0.67 (d, $J=8.5$ Hz, 3H), 0.85 (d, $J=6.0$ Hz, 3H), 1.21-2.05 (m, 7H), 3.21 (d, $J=4.1$ Hz, 0.8H), 3.41-3.78 (m, 2H), 3.80-4.07 (m, 2H), 4.19 (m, 0.2H), 4.95 (s, 1H), 5.23 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 6.26 (m, 1H), 7.42-7.68 (m, 3H), 7.87 (d, 15 $J=8.5$ Hz, 2H).

実施例84 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-(2,4,6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ)バレリルアミノ)-2-テトラヒドロピラノール(表-1の化合物番号473)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3331, 1655, 1541.

20 NMR (CDCl_3 , δ): 0.66-0.72 (m, 3H), 0.83-0.85 (m, 3H), 1.44-1.97 (m, 7H), 2.28 (s, 3H), 2.63 (s, 6H), 3.42-3.75 (m, 2H), 3.84-3.98 (m, 2H), 4.40-4.47 (m, 1H), 4.93 (s, 1H), 5.47 (d, $J=8.4$ Hz, 0.3H), 5.53 (d, $J=7.8$ Hz, 0.7H), 6.34 (m, 1H), 6.94 (s, 2H).

実施例 85 (3S)-3-[(S)-2-(N-アセチル-N-4-メチルフェニルスルホニル)アミノ-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランオール(表-1の化合物番号515)の製造

融点: 49-51°C

5 IR (KBr, cm^{-1}): 3414, 1701, 1674, 1524.
NMR (CDCl_3 , δ): 0.81-1.04 (m, 6H), 1.54-2.02 (m, 4H), 2.19-2.55 (m, 1H), 2.25 (s, 1.95H), 2.29 (s, 1.05H), 2.46 (s, 3H), 2.85 (d, $J=2.9\text{Hz}$, 0.35H), 3.23 (d, $J=3.2\text{Hz}$, 0.65H), 3.80-4.20 (m, 2H), 4.27-4.44 (m, 1H), 4.86 (t, $J=7.7\text{Hz}$, 0.35H), 4.97 (dd, $J=7.7\text{Hz}$, 6.3Hz, 0.65H), 5.24 (d, $J=2.9\text{Hz}$, 0.35H), 5.34 (dd, $J=3.2\text{Hz}$, 3.2Hz, 0.65H), 6.02 (d, $J=7.4\text{Hz}$, 0.35H), 6.41 (d, $J=7.9\text{Hz}$, 0.65H), 7.37 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 2H), 7.98 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 0.7H), 8.05 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 1.3H).

20 実施例 86 (3S)-3-[(S)-2-(N-アセチル-N-4-メトキシフェニルスルホニル)アミノ-4-メチルバレリルアミノ]-2-テトラヒドロフランオール(表-1の化合物番号516)の製造

融点: 48-51°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3414, 1701, 1595, 1522, 1501.

25 NMR (CDCl_3 , δ): 0.84-1.06 (m, 6H), 1.57-2.01 (m, 4H), 2.24 (s, 1.95H), 2.29 (s, 1.05H), 2.26-2.58 (m, 1H), 3.04 (d, $J=$

2. 6 Hz, 0. 35 H), 3. 42 (d, J=3. 1 Hz, 0. 65 H), 3. 80-4. 18 (m, 2H), 3. 89 (s, 1. 95 H), 3. 90 (s, 1. 05 H), 4. 24-4. 43 (m, 1H), 4. 87 (dd, J=7. 7 Hz, 6. 0 Hz, 0. 35 H), 4. 95 (t, J=6. 9 Hz, 0. 65 H), 5. 24 (d, J=2. 6 Hz, 0. 35 H), 5. 34 (dd, J=3. 1 Hz, 3. 1 Hz, 0. 65 H), 6. 04 (d, J=7. 1 Hz, 0. 35 H), 6. 42 (d, J=8. 0 Hz, 0. 65 H), 7. 04 (d, J=9. 0 Hz, 2H), 8. 04 (d, J=9. 0 Hz, 0. 7H), 8. 12 (d, J=9. 0 Hz, 1. 3H).

実施例 87 (3S)-3-{(S)-2-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバリレルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフランオール(表-3の化合物番号1126)の製造
融点: 186-188°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1644, 1549.
NMR (CDCl₃, δ): 0. 40 (d, J=6. 3 Hz, 1. 2 H), 0. 52 (d, J=5. 6 Hz, 1. 8 H), 0. 75-1. 00 (m, 9H), 1. 32-2. 07 (m, 7H), 2. 25 (m, 0. 6 H), 2. 40 (m, 0. 4 H), 3. 48 (d, J=2. 8 Hz, 0. 4 H), 3. 59 (m, 1H), 3. 73-3. 92 (m, 1. 2 H), 4. 02-4. 20 (m, 1. 4 H), 4. 21-4. 56 (m, 2H), 5. 30-5. 38 (m, 1H), 5. 59 (d, J=4. 8 Hz, 0. 4 H), 5. 68 (d, J=5. 9 Hz, 0. 6 H), 6. 82 (d, J=8. 3 Hz, 0. 6 H), 6. 95 (d, J=9. 7 Hz, 0. 4 H), 6. 99 (d, J=8. 6 Hz, 0. 6 H), 7. 08 (d, J=7. 0 Hz, 0. 4 H), 7. 47-7. 72 (m, 3H), 7. 91 (d,

$J = 8.5 \text{ Hz}$, 2 H).

実施例 88 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 716) の製造

- 5 参考例 1 で得られた (S) - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラン 244 mg を塩化メチレン 35 ml に溶解して -78°C に冷却し、 1.01 mol / 1 の水素化ジイソブチルアルミニウムのトルエン溶液 1.91 ml を加えた。 -78°C で 3 時間攪拌した後、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液
- 10 液および酢酸エチルを加え、室温に戻したのちセライトで濾過し、セライトを酢酸エチルでよく洗浄した。濾液を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、粗な (3S) - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラン (実施例 1 の化合物) を得た。これをピ
- 15 リジン 1 ml に溶かし、氷冷下無水酢酸 1.5 ml を加えてから氷冷下で 9 時間攪拌した後、メタノール 1.5 ml を加え濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、希塩酸、水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得られた残渣に酢酸エチル 2.5 ml およびヘキサン 2.5 ml を加え攪拌
- 20 し、生成した結晶を濾取し目的物 120 mg を得た。

収率: 44%

融点: $177 - 178^\circ\text{C}$

IR (KBr, cm^{-1}): $3409, 3100, 1753, 1659$.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.54 (d, $J = 6.3 \text{ Hz}$, 3 H),

- 25 0.80 (d, $J = 6.3 \text{ Hz}$, 3 H), 1.37 (m, 2 H), 1.59 (m, 1 H), 1.81 (m, 1 H), 2.16 (s, 3 H), 2.2

4 (m, 1H), 3.61 (m, 1H), 3.95 (ddd, J=9.3 Hz, 9.0 Hz, 7.5 Hz, 1H), 4.14 (ddd, J=9.3 Hz, 9.3 Hz, 3.0 Hz, 1H), 4.53 (m, 1H), 4.87 (d, J=6.6 Hz, 1H), 6.16 (d, J=4.5 Hz, 1H)
5) , 6.56 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 7.86 (dd, J=7.2 Hz, 1.5 Hz, 2H).

実施例 88 と同様の方法により、以下実施例 89 から実施例 117 の化合物を製造した。以下、その物性値を記す。

10 実施例 89 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 2 - tert - ブトキシカルボニルアミノ - 4 - メチルバリレルアミノ) テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 547) の製造

融点 : 143 - 145°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3297, 1748, 1659.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0.93 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.0 Hz, 3H), 1.45 (s, 9H), 1.49 (m, 1H), 1.67 (m, 2H), 1.83 (m, 1H), 2.11 (s, 3H), 2.36 (m, 1H), 3.96 (ddd, J=9.3 Hz, 9.3 Hz, 9.3 Hz, 1H), 4.06 (m, 1H), 4.14 (ddd, J=9.3 Hz, 9.3 Hz, 3.0 Hz, 1H), 4.57 (m, 1H), 4.84 (s, 1H), 6.17 (s, J=4.8 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H).

25 実施例 90 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ - 4 - メチルバレリルアミノ) テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 551) の製造

融点 : 162 - 164°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1687, 1655, 1535.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.94 (d, $J=6.2$ Hz, 3H),
0.95 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 1.83 (m, 1H), 2.0
7 (s, 3H), 2.11 (m, 3H), 2.36 (m, 1H), 3.9
5 3 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 1H), 4.0
9 (m, 2H), 4.79 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.3
2 (s, 1H), 6.04 (d, $J=4.2$ Hz, 1H), 6.17 (d
, $J=4.4$ Hz, 1H), 7.35 (m, 5H).

実施例 91 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 2 - (2
10 - クロロベンジロキシカルボニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ }
テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 558) の製造

融点 144 - 147°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3314, 3076, 1699, 1655,
1535.

15 NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 - 0.95 (m, 6H), 1.5
1 - 1.84 (m, 4H), 2.08 (s, 3H), 2.34 (m, 1H
) , 3.95 (dd, $J=8.8$ Hz, 7.4 Hz, 1H), 4.09 -
4.16 (m, 2H), 4.57 (m, 1H), 5.19 (d, $J=13$
. 0 Hz, 1H), 5.23 (s, 1H), 5.26 (d, $J=13.0$
20 Hz, 1H), 6.16 (d, $J=4.3$ Hz, 1H), 6.29 (s,
1H), 7.25 - 7.29 (m, 2H), 7.37 - 7.41 (m, 2
H).

実施例 92 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 4 - メチ
ル - 2 - (4 - メチルベンジロキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ }
25 テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 566) の製造

融点 : 161 - 163°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3314, 1691, 1651, 1539.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.91-0.93 (m, 6H), 1.46 (m, 4H), 2.07 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.33 (m, 1H), 3.94 (q, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 4.08-4.15 (m, 2H), 4.57 (m, 1H), 5.05 (d, $J=12.0\text{ Hz}$, 1H), 5.06 (s, 1H), 5.09 (d, $J=12.0\text{ Hz}$, 1H), 6.15 (d, $J=4.2\text{ Hz}$, 1H), 6.32 (s, 1H), 7.15 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 7.23 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H).

10 実施例93 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-2-(9-フルオレニルメトキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号571)の製造

融点: 158-159°C

15 IR (KBr, cm^{-1}) : 3308, 1746, 1692, 1657, 1537.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.94 (m, 6H), 1.52-1.74 (m, 3H), 1.64 (m, 1H), 2.06 (s, 3H), 2.36 (m, 1H), 3.96 (ddd, $J=7.8\text{ Hz}$, 7.8 Hz, 7.8 Hz, 1H), 4.11 (m, 2H), 4.19 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 4.43 (m, 2H), 4.56 (m, 1H), 5.15 (s, 1H), 6.06 (d, $J=4.2\text{ Hz}$, 1H), 6.22 (s, 1H), 7.31 (dd, $J=7.5\text{ Hz}$, 7.5 Hz, 2H), 7.41 (dd, $J=7.5\text{ Hz}$, 7.5 Hz, 2H), 7.58 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H), 7.77 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H).

25 実施例94 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-2-シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)テトラ

ヒドロフラン (表-2の化合物番号580) の製造

融点: 135-137°C

NMR (CDCl₃, δ): 0.92-0.95 (m, 6H), 1.26-1.88 (m, 14H), 2.10 (s, 3H), 2.35 (m, 1H), 3.97 (m, 1H), 4.10-4.16 (m, 2H), 4.51-4.64 (m, 2H), 5.03 (s, 1H), 6.16 (d, J=4.5 Hz, 1H), 6.40 (s, 1H).

実施例95 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-{(S)-4-メチル-2-(1-ナフチルアセチルアミノ)バレリルアミノ}テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号605) の製造

融点: 182-184°C

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1745, 1644, 1551.
NMR (CDCl₃, δ): 0.72 (d, J=6.4 Hz, 3H), 0.74 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.10-1.35 (m, 2H), 1.47 (m, 1H), 1.67 (m, 1H), 2.13 (s, 3H), 2.20 (m, 1H), 3.93 (ddd, J=8.9 Hz, 8.9 Hz, 8.9 Hz, 1H), 3.98-4.15 (m, 3H), 4.31 (m, 1H), 4.46 (m, 1H), 5.66 (d, J=8.1 Hz, 1H), 6.12 (d, J=4.6 Hz, 1H), 6.53 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.05-7.57 (m, 4H), 7.80-7.95 (m, 3H).

実施例96 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-{(S)-2-(2-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号633) の製造

融点: 165-166°C

IR (KBr, cm⁻¹): 3343, 3304, 1748, 1694.

1640, 1551.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.96 (d, J=5.7 Hz, 3H),
0.98 (d, J=5.7 Hz, 3H), 1.58-1.95 (m, 4H)
) , 2.10 (s, 3H), 2.39 (m, 1H), 3.95 (ddd,
5 J=9.0 Hz, 9.0 Hz, 7.4 Hz, 1H), 4.14 (ddd,
J=9.0 Hz, 9.0 Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.55-4.75
(m, 2H), 6.19 (d, J=4.8 Hz, 1H), 6.61 (d,
J=8.2 Hz, 1H), 7.00 (d, J=7.4 Hz, 0.5H),
7.02 (d, J=7.4 Hz, 0.5H), 7.15 (dd, J=8.
10 2 Hz, 7.5 Hz, 1H), 7.29 (ddd, J=6.8 Hz, 6.
8 Hz, 0.9 Hz, 1H), 7.55 (m, 1H), 8.06 (ddd
, J=7.9 Hz, 7.9 Hz, 1.9 Hz, 1H).

実施例97 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-{(S)-2-(4-
クロロベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}テトラヒドロ
15 フラン(表-2の化合物番号641)の製造

融点: 204-205°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3304, 1746, 1674, 1635.
NMR (CDCl₃, δ) : 0.96 (d, J=6.1 Hz, 3H),
0.97 (d, J=6.0 Hz, 3H), 1.58-1.78 (m, 3H
20) , 1.85 (m, 1H), 2.13 (s, 3H), 2.31 (m, 1H
) , 3.95 (m, 1H), 4.14 (ddd, J=8.6 Hz, 8.6
Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.50-4.70 (m, 2H), 6.20
(d, J=4.6 Hz, 1H), 6.62 (d, J=8.3 Hz, 1H)
, 6.81 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.41 (d, J=6.7 Hz
25 z, 2H), 7.73 (d, J=6.7 Hz, 2H).

実施例98 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-{(S)-4-メチ

ルー 2 - (2-メチルベンゾイルアミノ)バレリルアミノ}テトラヒドロ
フラン (表-2の化合物番号645)の製造

融点: 185-186°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3264, 1753, 1674, 1626.

5. NMR (CDCl_3 , δ): 0.99 (d, $J=5.6\text{ Hz}$, 6H),
1.55-1.93 (m, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.30 (m,
1H), 2.49 (s, 3H), 3.98 (m, 1H), 4.15 (d
dd, $J=6.3\text{ Hz}$, 6.3 Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.47-4
7.0 (m, 2H), 6.19 (d, $J=4.6\text{ Hz}$, 1H), 6.28
10 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 6.81 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H)
, 7.16-7.29 (m, 2H), 7.31-7.40 (m, 2H).

実施例 99 (2S, 3S) - 2-アセトキシ-3-{(S)-4-メチ
ルー 2 - (4-メチルベンゾイルアミノ)バレリルアミノ}テトラヒドロ
15 フラン (表-2の化合物番号647)の製造

融点: 199-200°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3318, 1746, 1663, 1630,
1534.

20 NMR (CDCl_3 , δ): 0.96 (d, $J=6.0\text{ Hz}$, 3H),
0.97 (d, $J=6.0\text{ Hz}$, 3H), 1.59-1.95 (m, 4H
, 2.12 (s, 3H), 2.29 (m, 1H), 2.40 (s, 3H
, 3.95 (m, 1H), 4.13 (ddd, $J=6.3\text{ Hz}$, 6.3
Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.49-4.70 (m, 2H), 6.19
(d, $J=4.6\text{ Hz}$, 1H), 6.58 (d, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H)
25 , 6.70 (d, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.24 (d, $J=7.8\text{ Hz}$
z, 2H), 7.69 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H).

実施例100 (2S, 3S) - 2-アセトキシ-3-((S)-4-メチル-2-(2, 4, 6-トリメチルベンゾイルアミノ)バレルルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号651)の製造

NMR (CDCl₃, δ) : 0.97 (d, J=5.0 Hz, 6H),
5 1.59-1.79 (m, 3H), 1.89 (m, 1H), 2.11 (s, 3H), 2.27 (s, 6H), 2.32 (s, 3H), 2.35 (m, 1H), 3.95 (m, 1H), 4.14 (ddd, J=9.0 Hz, 9.0 Hz, 2.8 Hz, 1H), 4.55-4.70 (m, 2H), 5.98 (d, J=8.1 Hz, 1H), 6.09 (d, J=4.6 Hz, 1H), 6.84 (s, 2H), 6.86 (d, J=7.5 Hz, 1H).

実施例101 (2S, 3S) - 3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレルルアミノ) - 2-プロピオニルオキシテトラヒドロフラン(表-2の化合物番号720)の製造

融点: 154-156°C

15 IR (KBr, cm⁻¹) : 3355, 3274, 1711, 1678.
NMR (CDCl₃, δ) : 0.56 (d, J=6.3 Hz, 3H), 0.80 (d, J=6.6 Hz, 3H), 1.17 (t, J=7.5 Hz, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.57 (m, 1H), 1.79 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 2.40 (qd, J=7.5 Hz, 16.8 Hz, 1H), 2.49 (qd, J=7.5 Hz, 16.8 Hz, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.94 (ddd, J=9.0 Hz, 9.0 Hz, 9.0 Hz, 1H), 4.13 (ddd, J=9.3 Hz, 9.0 Hz, 3.0 Hz, 1H), 4.92 (d, J=6.9 Hz, 1H), 6.17 (d, J=4.8 Hz, 1H), 6.49 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 7.86 (d, J=6.0 Hz, 2H).

実施例102 (2S, 3S) - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニ
ルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - ピバロイルオキシテトラヒド
ロフラン (表-2の化合物番号725) の製造

融点: 165 - 166°C

5 IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1640.

NMR (CDCl_3 , δ): 0.64 (d, $J=5.9$ Hz, 3H),
0.81 (d, $J=6.1$ Hz, 3H), 1.26 (s, 9H), 1.4
8 (m, 3H), 1.72 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 3.6
4 (m, 1H), 3.94 (ddd, $J=9.1$ Hz, 9.1 Hz, 9.
10 1 Hz, 1H), 4.10 (ddd, $J=9.1$ Hz, 9.1 Hz, 3.
1 Hz, 1H), 4.45 (m, 1H), 5.07 (d, $J=7.7$ Hz
. 1H), 6.10 (d, $J=4.5$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=$
8.4 Hz, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.61 (m, 1H), 7
. 86 (d, $J=7.1$ Hz, 2H).

15 実施例103 (2S, 3S) - 2 - ベンゾイルオキシ - 3 - ((S) -
4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒド
ロフラン (表-2の化合物番号728) の製造

融点: 184 - 185°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3353, 3260, 1698, 1678.
20 NMR (CDCl_3 , δ): 0.55 (d, $J=6.0$ Hz, 3H),
0.69 (d, $J=6.0$ Hz, 3H), 1.30 - 1.48 (m, 3H
) , 1.90 (m, 1H), 2.30 (m, 1H), 3.64 (m, 1H
) , 4.00 (ddd, $J=9.3$ Hz, 9.0 Hz, 7.5 Hz, 1H
) , 4.19 (ddd, $J=9.3$ Hz, 9.3 Hz, 3.0 Hz, 1H
25) , 4.51 (m, 1H), 5.13 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 6
. 37 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 6.39 (d, $J=4.2$ Hz,

1 H), 7.26-7.50 (m, 4H), 7.58 (m, 2H), 7.80 (dd, $J=7.5$ Hz, 1.8 Hz, 2H), 8.06 (dd, $J=7.8$ Hz, 0.9 Hz, 2H).

5 実施例104 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-{(S)-2-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号754)の製造

融点: 136-137°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3335, 3258, 1744, 1651, 1535.

10 NMR (CDCl_3 , δ): 0.61 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 0.83 (d, $J=6.3$ Hz, 3H), 1.35-1.62 (m, 3H), 1.80 (m, 1H), 2.15 (s, 3H), 2.21 (m, 1H), 3.61 (m, 1H), 3.97 (ddd, $J=9.1$ Hz, 9.1 Hz, 9.1 Hz, 1H), 4.14 (ddd, $J=9.1$ Hz, 9.1 Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.50 (m, 1H), 5.09 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 6.15 (d, $J=4.6$ Hz, 1H), 6.42 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J=8.6$ Hz, 2H), 7.80 (d, $J=8.6$ Hz, 2H).

20 実施例105 (2S, 3S)-3-{(S)-2-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-ピバロイルオキシテトラヒドロフラン(表-2の化合物番号755)の製造

融点: 155-156°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3366, 3229, 1726, 1684, 1664, 1543.

25 NMR (CDCl_3 , δ): 0.70 (d, $J=6.3$ Hz, 3H), 0.83 (d, $J=6.4$ Hz, 3H), 1.25 (s, 9H), 1.4

0-1.82 (m, 4H), 2.23 (m, 1H), 3.62 (dd, J = 12.5 Hz, 6.4 Hz, 1H), 3.96 (dddd, J = 8.9 Hz, 8.9 Hz, 8.9 Hz, 1H), 4.11 (dddd, J = 8.9 Hz, 8.9 Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.45 (m, 1H), 5.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.10 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.75-7.85 (m, 2H).

実施例106 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-4-メチル-2-(4-メチルフェニルスルホニルアミノ)バレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号761)の製造

融点: 159-160°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3372, 1721, 1674, 1535.

NMR (CDCl₃, δ): 0.52 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.80 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.56 (m, 1H), 1.83 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.22 (m, 1H), 2.44 (s, 3H), 3.59 (m, 1H), 3.94 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.81 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 6.15 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 6.35 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 8.0 Hz, 2H).

実施例107 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-4-メチル-2-(2,4,6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ)バレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号765)の製造

融点: 158-159°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3416, 3191, 1755, 1661, 1605, 1535.

NMR (CDC1₃, δ) : 0.56 (d, J=6.3 Hz, 3H),
0.79 (d, J=6.3 Hz, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.5
8 (m, 1H), 1.81 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.2
4 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (s, 6H), 3.5
5 6 (m, 1H), 3.94 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.5
2 (m, 1H), 5.00 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.15 (d
, J=4.6 Hz, 1H), 6.61 (d, J=8.7 Hz, 1H), 6
. 97 (s, 2H).

実施例108 (2S, 3S) - 2 - アセチル - 3 - { (S) - 2 - (4
10 - tert - ブチルフェニルスルホニルアミノ) - 4 - メチルバレリルア
ミノ } テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号768) の製造

NMR (CDC1₃, δ) : 0.44 (d, J=6.2 Hz, 3H),
0.77 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.23 - 1.43 (m, 2H
) , 1.34 (s, 9H), 1.55 (m, 1H), 1.85 (m, 1H
15) , 2.17 (s, 3H), 2.20 (m, 1H), 3.59 (m, 1H
) , 3.95 (m, 1H), 4.13 (ddd, J=9.0 Hz, 9.0
Hz, 2.9 Hz, 1H), 4.57 (m, 1H), 4.95 (d, J=
6.4 Hz, 1H), 6.17 (d, J=4.6 Hz, 1H), 6.77
(d, J=8.7 Hz, 1H), 7.53 (d, J=8.6 Hz, 2H)
20 , 7.78 (d, J=8.6 Hz, 2H).

実施例109 (2S, 3S) - 2 - アセチル - 3 - { (S) - 2 - (4
- メトキシフェニルスルホニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } テ
トラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号771) の製造

融点 : 157 - 158 °C

25 IR (KBr, cm⁻¹) : 3329, 3273, 1746, 1659,
1597, 1544, 1501.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.54 (d, J=6.1 Hz, 3H),
0.81 (d, J=6.3 Hz, 3H), 1.38 (m, 2H), 1.5
6 (m, 1H), 1.84 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.2
2 (m, 1H), 3.56 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.9
5 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.8
1 (d, J=6.4 Hz, 1H), 6.16 (d, J=4.5 Hz, 1H
) , 6.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 6.99 (d, J=8.6
Hz, 2H), 7.79 (d, J=8.6 Hz, 2H).

実施例110 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 4 - メ
10 チル - 2 - (2 - ナフチルスルホニルアミノ) バレリルアミノ } テトラヒ
ドロフラン (表 - 2 の化合物番号780) の製造

融点 : 158 - 159°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3337, 3275, 1723, 1676,
1543.

15 NMR (CDCl₃, δ) : 0.48 (d, J=6.1 Hz, 3H),
0.76 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.33 - 1.75 (m, 4H
) , 1.97 (m, 1H), 2.15 (s, 3H), 3.68 (m, 1H
) , 3.87 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.42 (m, 1H
) , 5.19 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.12 (d, J=4.6
20 Hz, 1H), 6.53 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.58 - 7.
71 (m, 2H), 7.82 (dd, J=8.7 Hz, 1.9 Hz, 1H
) , 7.87 - 8.03 (m, 3H), 8.44 (s, 1H).

実施例111 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 4 - メ
チル - 2 - (3 - ピリジルスルホニルアミノ) バレリルアミノ } テトラヒ
25 ドロフラン (表 - 2 の化合物番号782) の製造

融点 : 160 - 161°C

3 8 1

IR (KBr, cm^{-1}) : 3410, 3075, 1753, 1657,
1535, 1342, 1172.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.68 (d, $J=5.9\text{ Hz}$, 3H),
0.85 (d, $J=5.9\text{ Hz}$, 3H), 1.40-1.62 (m, 3H)
5) , 1.80 (m, 1H), 2.14 (s, 3H), 2.22 (m, 1H)
) , 3.73 (m, 1H), 3.96 (ddd, $J=9.1\text{ Hz}$, 8.9
Hz, 8.9 Hz, 1H), 4.03 (ddd, $J=9.1\text{ Hz}$, 9.1
Hz, 3.0 Hz, 1H), 4.45 (m, 1H), 5.46 (m, 1H
) , 6.13 (d, $J=4.6\text{ Hz}$, 1H), 6.32 (d, $J=8.6$
10 Hz, 1H), 7.48 (m, 1H), 8.16 (ddd, $J=8.2\text{ Hz}$
z, 1.9 Hz, 1.9 Hz, 1H), 8.83 (dd, $J=4.9\text{ Hz}$
, 1.5 Hz, 1H), 9.07 (d, $J=2.3\text{ Hz}$, 1H).

実施例 112 (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-2-(
N-アセチル-N-(4-メチルフェニルスルホニル)アミノ)-4-メ
15 チルバレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号1065
)の製造

融点 : 154°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3387, 1746, 1674, 1522.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.84 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 3H),
20 0.93 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 3H), 1.58 (m, 2H), 1.8
4 (m, 1H), 2.09 (m, 1H), 2.12 (s, 3H), 2.3
3 (s, 3H), 2.38 (m, 1H), 2.47 (s, 3H), 3.9
6 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.7
8 (t, $J=6.8\text{ Hz}$, 1H), 6.14 (d, $J=4.6\text{ Hz}$, 1H
25) , 6.50 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.39 (d, $J=8.1$
Hz, 2H), 7.91 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 2H).

実施例 113 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 2 - (N - アセチル - N - (4 - メトキシフェニルスルホニル) アミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 1066) の製造

5 融点 : 64 - 66°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3397, 1748, 1595, 1530.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85 (d, $J=6.2$ Hz, 3H),

0.94 (d, $J=6.3$ Hz, 3H), 1.59 (m, 2H), 1.8

5 (m, 1H), 2.08 (m, 1H), 2.12 (s, 3H), 2.3

10 2 (s, 1H), 2.37 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.9

6 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.7

9 (t, $J=6.8$ Hz, 1H), 6.15 (d, $J=4.7$ Hz, 1H

), 6.51 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J=9.0$

Hz, 2H), 7.97 (d, $J=9.0$ Hz, 2H).

15 実施例 114 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ - 4 - メチルバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 983) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 1693, 1653, 1537.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.90 - 0.93 (m, 6H), 1.4

20 3 - 1.77 (m, 7H), 2.11 (s, 3H), 3.65 - 3.74

(m, 2H), 4.08 - 4.17 (m, 2H), 5.09 (s, 2H)

, 5.30 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 5.96 (d, $J=2.7$ Hz,

z, 1H), 6.17 (s, 1H), 7.34 (m, 5H).

25 実施例 115 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 2 - (2 - フルオロベンゾイルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロピラン (表 - 2 の化合物番号 1000) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3298, 2947, 1633, 1545.

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.91-0.98 (m, 6H), 1.65-1.77 (m, 7H), 2.13 (s, 3H), 3.64-3.77 (m, 2H), 3.90 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 4.60 (s, 1H), 6.00 (d, $J=3.3\text{Hz}$, 1H), 6.42 (s, 1H), 7.13 (m, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.48 (m, 1H), 8.02 (m, 1H).

10 実施例 116 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - { (S) - 4 - メチル - 2 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ } - 2 - テトラヒドロピラン (表 - 2 の化合物番号 1023) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3418, 1658, 1606, 1523.

15 NMR (CDCl_3 , δ) : 0.57 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 3H), 0.79 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 3H), 1.32-1.78 (m, 7H), 2.16 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.60 (s, 6H), 3.49 (m, 1H), 3.61-3.78 (m, 2H), 4.08 (m, 1H), 5.08 (d, $J=7.2\text{Hz}$, 1H), 5.94 (d, $J=3.0\text{Hz}$, 1H), 6.33 (d, $J=8.7\text{Hz}$, 1H), 6.95 (s, 2H).

20 実施例 117 (2S, 3S) - 3 - { (S) - 2 - (4 - tert - ブチルフェニルスルホニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ } - 2 - ピバロイルオキシテトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 1397) の製造

融点 : 166 - 167°C

25 IR (KBr, cm^{-1}) : 3360, 1728, 1682, 1665, 1547.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.55 (d, J=6.0 Hz, 3H),
0.78 (d, J=6.0 Hz, 3H), 1.25 (s, 9H), 1.3
2 (s, 9H), 1.38-1.82 (m, 4H), 2.25 (m, 1H
) , 3.60 (m, 1H), 3.95 (m, 1H), 4.12 (ddd,
5 J=9.0 Hz, 9.0 Hz, 3.0 Hz, 1H), 4.46 (m, 1H
) , 5.05 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.10 (d, J=4.5
Hz, 1H), 6.41 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.52 (d,
J=8.6 Hz, 2H), 7.78 (d, J=8.6 Hz, 2H).

実施例 118 (3S)-2-メトキシ-3-((S)-4-メチル-2
10 -フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-
2の化合物番号741)の製造

実施例 88 で得られた (2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)
-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)テトラヒ
ドロフラン 43 mg をメタノール 40 ml に溶かし、4 規定の塩化水素含
15 有酢酸エチル 1 ml を加えた。室温で一晩攪拌した後、飽和重曹水 7 ml
を加え、溶媒を留去した。残渣に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出し
た。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。乾燥剤
を濾過してから濾液を濃縮し、得られた粗生成物にヘキサンおよびジエチ
ルエーテルを加えて攪拌した後、濾過すると目的物 29 mg が得られた。

20 収率 : 65%

融点 : 84-90°C

IR (KBr, cm⁻¹) : 3268, 1647, 1618.

NMR (CDCl₃, δ) : 0.71 (d, J=6.6 Hz, 2.1H
) , 0.80 (d, J=6.6 Hz, 0.9H), 0.84 (d, J=6
25 . 6 Hz, 2.1H), 0.88 (d, J=6.6 Hz, 0.9H), 1
. 42-1.49 (m, 3H), 1.61 (m, 1H), 2.08 (m,

0. 3 H), 2. 27 (m, 0. 7 H), 3. 30 (s, 2. 1 H), 3. 37 (s, 0. 9 H), 3. 63 (m, 1 H), 3. 69 (m, 0. 3 H), 3. 81-4. 11 (m, 1. 7 H), 4. 13 (m, 1 H), 4. 66 (s, 0. 7 H), 4. 71 (d, J=4. 8 Hz, 0. 3 H), 5. 4. 66 (d, J=7. 8 Hz, 0. 7 H), 5. 23 (d, J=8. 4 Hz, 0. 3 H), 5. 96 (d, J=7. 8 Hz, 0. 7 H), 6. 17 (d, J=8. 7 Hz, 0. 3 H), 7. 47-7. 62 (m, 3 H), 7. 86 (d, J=7. 5 Hz, 2 H).

試験例1 システインプロテアーゼ阻害活性の測定

10 カテプシンB (シグマ社、C-6286)の阻害活性は、文献 (Biochemical Journal, 201巻、189ページ、1982年) 記載の方法に準じて測定した。その結果を表-5に示す。

15 m-カルpainは、ラットの脳より文献 (Journal of Biological Chemistry, 259巻、3210ページ、1984年) 記載の方法により精製し、その阻害活性は、文献 (Journal of Biological Chemistry, 259巻、12489ページ、1984年) 記載の方法に準じて測定した。その結果を表-6に示す。

20 表-5および表-6より、本発明の化合物は、パpain、カテプシンB、カテプシンL、カルpain等のシステインプロテアーゼに対して、強い阻害活性を示すことがわかる。

表-5 カテプシンBの阻害活性

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)	実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)
1 (196)	0.42	40 (113)	1.00
4 (20)	0.70	41 (114)	0.87
5 (21)	0.98	42 (115)	0.55
6 (22)	1.35	43 (121)	0.14
7 (23)	0.90	44 (125)	1.45
10 (27)	0.37	45 (126)	0.49
11 (28)	2.15	46 (127)	0.27
12 (29)	1.20	48 (130)	0.086
13 (31)	0.38	50 (134)	0.20
15 (37)	0.70	51 (137)	0.21
16 (38)	1.00	53 (140)	0.15
17 (40)	0.64	55 (142)	1.65
18 (44)	0.58	56 (144)	0.90
19 (46)	0.89	57 (148)	0.24
20 (47)	1.05	58 (152)	0.46
21 (49)	1.17	59 (156)	0.80
24 (53)	2.90	60 (157)	0.034
25 (54)	2.90	61 (161)	1.20
27 (60)	1.20	62 (170)	0.50
28 (61)	1.70	65 (187)	0.19
33 (85)	0.95	75 (229)	2.40
34 (90)	1.35	77 (232)	0.40
39 (112)	0.20	78 (246)	0.30
実施例番号の化合物 (表-3の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)		
87 (1126)	1.30		

表-6 カルパインの阻害活性

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)	実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)
1 (196)	0.62	27 (60)	0.65
4 (20)	0.90	28 (61)	0.52
5 (21)	2.30	33 (85)	0.11
6 (22)	2.30	34 (90)	0.33
7 (23)	2.40	39 (112)	0.37
9 (25)	1.55	40 (113)	0.17
10 (27)	0.96	41 (114)	1.15
11 (28)	1.10	42 (115)	0.82
12 (29)	0.65	43 (121)	0.36
13 (31)	0.66	44 (125)	0.58
15 (37)	0.68	45 (126)	0.56
16 (38)	0.34	46 (127)	0.33
17 (40)	0.39	47 (129)	2.30
18 (44)	0.44	48 (130)	0.38
19 (46)	0.48	49 (131)	0.68
20 (47)	0.56	50 (134)	0.65
21 (49)	0.34	51 (137)	0.48
22 (51)	0.41	52 (138)	0.34
23 (52)	1.10	53 (140)	0.67
24 (53)	1.30	54 (141)	0.70
25 (54)	1.05	55 (142)	0.84
26 (57)	1.40	56 (144)	0.64

表-6 (つづき)

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)
57 (148)	0.25
58 (152)	0.44
59 (156)	0.40
60 (157)	0.47
61 (161)	0.35
62 (170)	1.00
63 (175)	0.35
65 (187)	0.70
66 (202)	0.60
68 (205)	0.56
69 (208)	0.62
70 (211)	0.50
71 (215)	0.45
72 (218)	0.39
73 (221)	0.74
74 (227)	0.95
75 (229)	0.38
76 (230)	0.36
77 (232)	1.00
80 (320)	2.80
81 (468)	1.55
実施例番号の化合物 (表-3の化合物番号)	IC ₅₀ (μ M)
87 (1126)	0.78

試験例 2 血液中での活性本体の生成

実施例 88 で得られた (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒドロフランをアセトニトリルに溶かし、最終濃度が 100 μ M になるようにラットの血清に添加した。37°C で 5 分間インキュベーションした後、アセトニトリルを加え、遠心分離して得られた溶液部分を HPLC で測定した。その結果を第 1 図に示す。また、対比のため、実施例 1 で得られた (3S) - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノールおよび実施例 88 で得られた (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒドロフランをアセトニトリルに溶かしたものを HPLC で測定した。その結果を第 2 図に示す。第 1 図および第 2 図より、加えた (2S, 3S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒドロフランの 97% が加水分解され、活性本体である (3S) - 3 - ((S) - 4 - メチル - 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (実施例 1 の化合物) に変換されていることが判明した。ヒトおよびイヌの血清でも同様の操作を行ない、活性本体が生成することを確認した。

HPLC の条件は以下の通り。

カラム Nucleosil 100, C₁₈
 4.6 × 250 mm (ナーゲル社製)

カラム温度 50°C

移動相 CH₃CN : H₂O : PIC A Low UV (Waters社製)

 22 : 78 : 1

流 速 1 ml/min

検出波長 UV 222 nm

この結果より、本発明の含酸素複素環誘導体は、生体内ですみやかに活性本体であるラクトール誘導体に変換されることがわかる。

試験例 3 急性毒性試験

- 5 SD雌雄ラットに本発明の化合物を0.5% CMC-Na水溶液に懸濁させたものを強制経口投与し、7日間症状観察を行った。

実施例 88、96、106の化合物のLD₅₀値は、いずれも>2000 mg/kgであった。

試験例 4 製剤例

10 (1) 錠剤

下記の成分を常法に従って混合し、慣用の装置により打錠した。

	実施例 88 の化合物	30 mg
	結晶セルロース	60 mg
	コーンスターチ	100 mg
15	乳 糖	200 mg
	ステアリン酸マグネシウム	4 mg

(2) 軟カプセル剤

下記の成分を常法に従って混合し、軟カプセルに充填した。

	実施例 88 の化合物	30 mg
20	オリーブ油	300 mg
	レシチン	20 mg

(3) 注射用製剤

下記の成分を常法に従って混合し、1mlのアンブルを調整した。

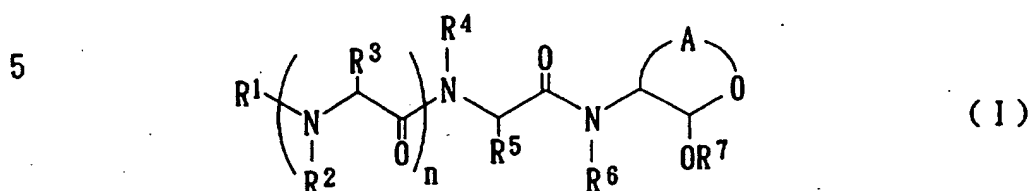
	実施例 25 の化合物	3 mg
25	塩化ナトリウム	4 mg
	注射用蒸留水	1 ml

産業上の利用可能性

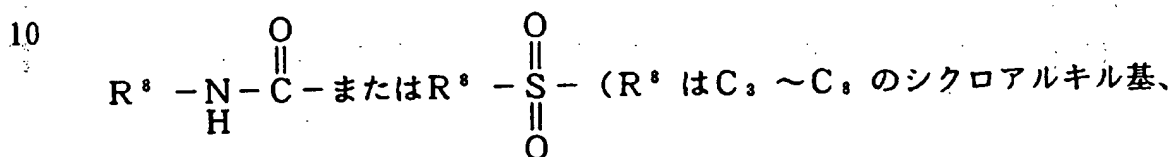
本発明の含酸素複素環誘導体は、パパイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン、インターロイキン1 β 変換酵素等のシステインプロテアーゼに対して強い阻害作用を示し、また経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にもすぐれていることから、筋ジストロフィー、筋萎縮症、心筋梗塞、脳卒中、アルツハイマー病、頭部外傷等の意識障害や運動障害、多発性硬化症、末梢神経のニューロパシー、白内障、炎症、アレルギー、劇症肝炎、骨粗鬆症、高カルシウム血症、乳癌、前立腺癌、前立腺肥大等の治療薬として、あるいは癌の増殖抑制、転移予防薬、血小板の凝集阻害薬として用いることができる。

請 求 の 範 囲

1. 下記一般式 (I)



(上記一般式 (I) 中、 R^1 は水素原子、 R^4 は $\text{O}=\text{C}-$ 、 R^4 は $\text{O}=\text{C}-$ 、



$\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ のシクロアルキルオキシ基、フルオレニル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールチオ基、置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_{20}$ のアルキル基； $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ のシクロアルキル基；置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ のアルケニル基；または置換基を有していてもよい複素環残基を表す) を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 はそれぞれ独立して水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ のアルキル基または $\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ のアルカノイル基を表し、 R^3 および R^5 はそれぞれ独立して水素原子；置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基、水酸基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ のアルコキシ基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ のアルキルチオ基および $\text{C}_7 \sim \text{C}_{12}$ のアラルキルオキ

15

20

25

シ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₂₀のアルキル基；または置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基

- 5 を表し、R⁷ は水素原子、C₁～C₆のアルキル基または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R⁹ はC₁～C₁₀のアルキル基または置換基を有していてもよいC₆～C₁₂のアリール基を表す) を表し、AはC₁～C₃のアルキル基を有していてもよいC₁～C₃のアルキレン基を表し、nは0または1を表す) で表される含酸素複素環誘導体、その塩、その溶媒和物またはその水和物。

- 10 2. R¹ が水素原子、R⁸ - $\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ 、R⁸ - O - $\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ 、R⁸ - $\underset{\text{H}}{\text{N}} - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ 、
またはR⁸ - $\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{S}} -$ (R⁸ はC₃～C₆のシクロアルキル基、フルオレニル

- 15 基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールオキシ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールチオ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₂₀のアルキル基；C₃～C₆のシクロアルキル基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基で置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基；または置換基を有していてもよい複素環残基を表す) であり、R³ およびR⁵ がそれぞれ独立して水素原子；または置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基およびC₁～C₆のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₂₀のアルキル基である請求項1記載の化合物。

- 25 3. R²、R⁴ およびR⁶ がそれぞれ独立して水素原子またはC₁～C₆

のアルキル基である請求項 2 記載の化合物。

4. n が 0 である請求項 3 記載の化合物。

5. R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールスルホニル基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；または置換基を有していてもよい複素環残基を表す) であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim$

15 C_{20} のアルキル基であり、 R^7 が水素原子または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す) であり、A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基であり、n が 0 である請求項 1 記載の化合物。

6. R^7 が水素原子である請求項 5 記載の化合物。

20 7. R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^9 は炭素数 1 ~ 10 のアルキル基を表す) である請求項 5 記載の化合物。

25 8. R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{C} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す) であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim$

C₂₀のアルキル基であり、R⁷がR⁹- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C- (R⁹はC₁~C₁₀のアルキル基を表す)であり、AがC₁~C₃のアルキレン基であり、nが0である請求項1記載の化合物。

5

9. R¹がR⁸- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C- (R⁸はC₃~C₈のシクロアルキル基、フルオレニル基、置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂₀のアルキル基; C₃~C₈のシクロアルキル基; または置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基を表す)であり、R²、R⁴およびR⁶が水素原子であり、R³およびR⁵がそれぞれ独立して水素原子; または置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基およびC₁~C₈のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂₀のアルキル基であり、R⁷が

15

水素原子またはR⁹- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C- (R⁹はC₁~C₁₀のアルキル基を表す)であり、AがC₁~C₃のアルキレン基であり、nが0である請求項1記載の化合物。

10. R⁷が水素原子である請求項9記載の化合物。

20

11. R⁷がR⁹- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C- (R⁹はC₁~C₁₀のアルキル基を表す)である請求項9記載の化合物。

25

12. R¹がR⁸- $\overset{\text{O}}{\parallel}$ C- (R⁸はフルオレニル基および置換基を有していてもよいC₆~C₁₄のアリール基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂₀のアルキル基; またはC₃~C₈の

シクロアルキル基を表す)であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基であり、

5 R^7 が $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す) であり、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基であり、 n が 0 である請求項 1 記載の化合物。

13. R^1 が $R^8 - \underset{\text{H}}{\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{N}}} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim$

10 C_{14} のアリール基を表す) であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基であり、

R^7 が水素原子または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す) であり、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基であり、 n が 0 である請求項 1 記載の化合物。

15 14. R^7 が水素原子である請求項 13 記載の化合物。

15. R^1 が $R^8 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\underset{\text{O}}{\text{S}}} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$

20 のアリール基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す) であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基であり、 R^7 が水素原子、 $C_1 \sim C_3$ のアル

25 キル基または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す) であり、 A が $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基であり、 n が 0 である請求項 1 記載の化合物。

16. R^7 が水素原子である請求項15記載の化合物。

17. R^7 が $C_1 \sim C_3$ のアルキル基である請求項15記載の化合物。

5 18. R^1 が $R^8 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$

のアリール基を表す) であり、 R^7 が $C_1 \sim C_3$ のアルキル基である請求項15記載の化合物。

10 19. R^7 が $R^9 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す) である請求項15記載の化合物。

20. R^7 が $R^9 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} -$ (R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す) である請求項15記載の化合物。

15 21. R^1 が $R^8 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} -$ (R^8 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$

20 のアリール基を表す) であり、 R^7 が $R^9 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} -$ (R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す) である請求項15記載の化合物。

22. R^1 が $R^8 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} -$ 、 $R^8 - \text{O} - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C} \end{array} -$ 、 $R^8 - \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{S} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} -$ (R^8 は (1)

25 $C_1 \sim C_3$ のアルキル基、ハロゲン原子および $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基; $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基; または $C_1 \sim C_3$ のアルキ

ロ基、フルオレニル基およびC₁～C₃のアルコキシ基からなる群より選
 ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基 (4)
 C₁～C₃のアルキル基により置換されていてもよいC₆～C₁₄のアリ
 ル基により置換されたC₂～C₅のアルケニル基 (5) ピリジル基 (6)
 5 C₁～C₃のアルキル基から選ばれる1以上の置換基を有していても
 よいイミダゾール基 (7) クロマニル基 (8) フリル基 (9) テト
 ラヒドロフリル基または(10) テトラヒドロピラニル基を表す) であり
 、R²、R⁴およびR⁶が水素原子であり、R³がC₁～C₆のアルキル
 基であり、R⁵がC₆～C₁₄のアリール基で置換されていてもよいC₁～

10

C₆のアルキル基であり、R⁷が水素原子またはR⁹-C(=O)- (R⁹はC₁
 ～C₆のアルキル基を表す) である請求項1記載の化合物。

24. AがC₁～C₃のアルキル基を有していてもよいエチレン基であ
 り、nが0である請求項23記載の化合物。

15

25. R¹がR⁸-C(=O)-、R⁸-O-C(=O)-、R⁸-S(=O)₂- (R⁸はC₁～

20

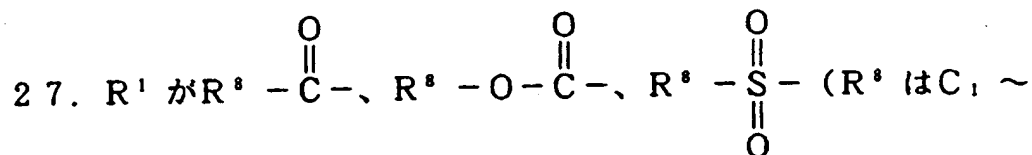
C₃のアルキル基で置換されていてもよいC₆～C₁₄のアリール基で置換
 されていてもよいC₁～C₃のアルキル基; またはC₁～C₃のアルキル
 基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール
 基を表す) であり、R²、R⁴およびR⁶が水素原子であり、R³および

R⁵がC₁～C₆のアルキル基であり、R⁷が水素原子またはR⁹-C(=O)-
 (R⁹はC₁～C₆のアルキル基を表す) である請求項1記載の化合物。

25

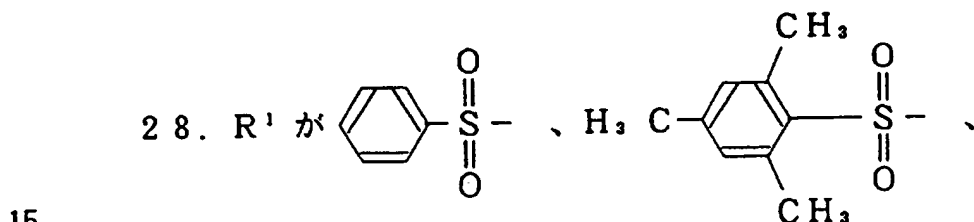
26. nが0である請求項25記載の化合物。

4 0 0

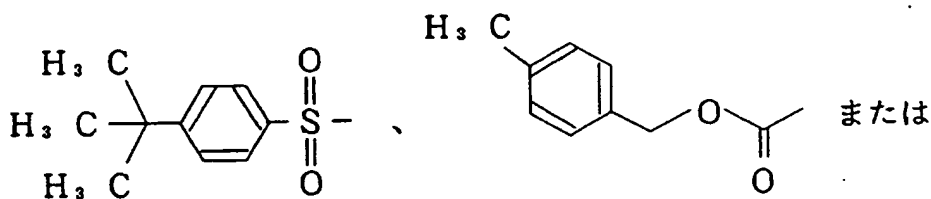


C_6 のアルキル基で置換されているもよいフェニル基で置換された $C_1 \sim$
 5 C_6 のアルキル基；または $C_1 \sim C_6$ のアルキル基から選ばれる 1 以上の置換基を有しているもよいフェニル基を表す) であり、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^5 が $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 R^7 が水素原子

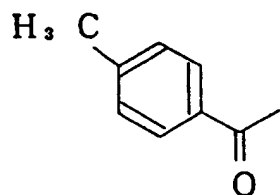
または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を表す) であり、A が
 10 メチル基を有しているもよいエチレン基であり、n が 0 である請求項 1 記載の化合物。



15



20



であり、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^5 が

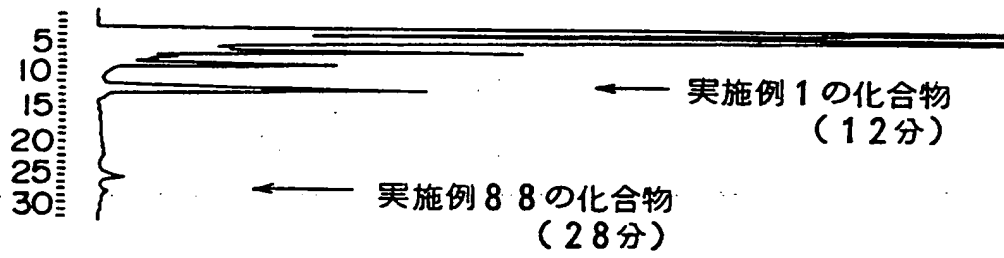
25 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 R^7 が水素原子または $R^9 - \overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}} -$ (R^9 は $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を表す) であり、A がメチル基を有しているも

よいエチレン基であり、 n が0である請求項1記載の化合物。

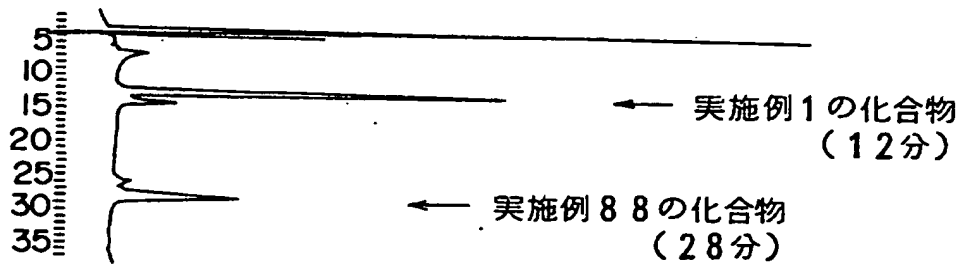
29. 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなる医薬組成物。

30. 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有して
5 なるシステインプロテアーゼの異常昂進に起因する疾患のための医薬組成物。

第 1 図



第 2 図



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP96/00286

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ C07D305/08, 307/22, 309/14, C07H5/06, 15/18, A61K31/335, 31/34, 31/35, 31/70

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ C07D305/08, 307/22, 309/14, C07H5/06, 15/18, A61K31/335, 31/34, 31/35, 31/70

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E	EP, 641800, A1 (Takeda Chemical Industries, Ltd.), March 8, 1995 (08. 03. 95) Claim & JP, 8-104685, A	1 - 30

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

April 24, 1996 (24. 04. 96)

Date of mailing of the international search report

May 14, 1996 (14. 05. 96)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl¹ C07D305/08、307/22、309/14、C07H5/06、15/18、
A61K31/335、31/34、31/35、31/70

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl¹ C07D305/08、307/22、309/14、C07H5/06、15/18、
A61K31/335、31/34、31/35、31/70

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
E	EP、641800、A1 (Takeda Chemical Industries, Ltd.) 8. 3月. 19 95 (08. 03. 95) 請求の範囲 & JP、8-104685、A	1-30

C欄の続きにも文献が列举されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

24. 04. 96

国際調査報告の発送日

14.05.96

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号100
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

後 藤 圭 次

4C 7329

印

電話番号 03-3581-1101 内線 3454